

⑯ BUNDESREPUBLIK
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES
PATENTAMT

⑯ Offenlegungsschrift
⑯ DE 44 23 612 A 1

⑯ Aktenzeichen: P 44 23 612.3
⑯ Anmeldetag: 6. 7. 94
⑯ Offenlegungstag: 11. 1. 96

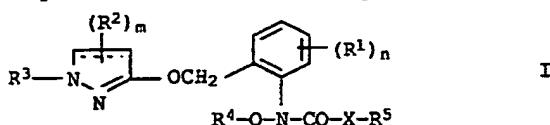
⑯ Int. Cl. 6:
C 07 D 231/14
C 07 D 231/08
C 07 D 401/10
C 07 D 401/04
C 07 D 403/04
C 07 B 41/04
A 01 N 47/24
// C07D 521/00
(C07D 401/10, 231:14,
231:08, 213:24) (C07D
401/04, 231:14,
231:08, 213:72) (C07D
403/04, 231:14,
231:08, 241:20) C07C
205/06, 205/12

⑯ Anmelder:
BASF AG, 67063 Ludwigshafen, DE

⑯ Erfinder:
Müller, Bernd, Dr., 67227 Frankenthal, DE; König,
Hartmann, Dr., 67117 Limburgerhof, DE; Kirstgen,
Reinhard, Dr., 67434 Neustadt, DE; Oberdorf, Klaus,
Dr., 69117 Heidelberg, DE; Röhl, Franz, Dr., 67105
Schifferstadt, DE; Götz, Norbert, Dr., 67547 Worms,
DE; Sauter, Hubert, Dr., 68167 Mannheim, DE;
Lorenz, Gisela, Dr., 67434 Neustadt, DE;
Ammermann, Eberhard, Dr., 64646 Heppenheim, DE

⑯ 2-[(Dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]-anilide, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung

⑯ 2-[(Dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]-anilide der Formel I ihre Verwendung.



in der --- für eine Einfach- oder Doppelbindung steht und die Indices und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

n 0, 1, 2, 3 oder 4;
m 0, 1 oder 2;

X eine direkte Bindung oder CH_2 , O oder NR^a ;

R^a Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl;

R^1 Nitro, Cyano, Halogen,

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Alkoxy, Alkenyloxy oder Alkinyloxy;

R^2 Nitro, Cyano, Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Alkylthio oder Alkoxy carbonyl;

R^3 ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Heterocycl, Aryl oder Heteroaryl;

R^4 Wasserstoff,

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkyl carbonyl oder Alkoxy carbonyl;

R^5 Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl,

Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung und

DE 44 23 612 A 1

Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen

BUNDESDRUCKEREI 11. 95 508 062/295

37/34

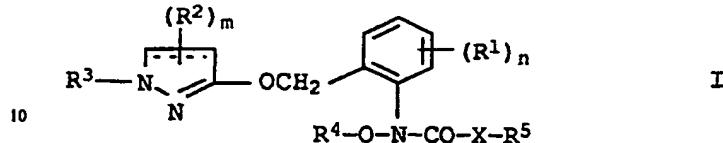
DE 44 23 612 A 1

4p

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft 2-[(Dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]-anilide der Formel I

5



10

in der ... für eine Einfach- oder Doppelbindung steht und die Indices und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

15 n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist;
 m 0, 1 oder 2, wobei die Substituenten R² verschieden sein können, wenn m größer als 1 ist;
 X eine direkte Bindung, O oder NR^a;
 R^a Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl;
 R¹ Nitro, Cyano, Halogen,
 20 ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy oder
 für den Fall, daß n für 2 steht zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 2 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;
 25 R² Nitro, Cyano, Halogen, C₁—C₄-Alkyl, C₁—C₄-Halogenalkyl, C₁—C₄-Alkoxy, C₁—C₄-Alkylthio oder
 C₁—C₄-Alkoxy carbonyl;
 R³ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl;
 ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder
 30 ein ggf. subst. ein- oder zweikerniger aromatischer Rest, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann;
 R⁴ Wasserstoff,
 ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkyl carbonyl oder Alkoxy carbonyl;
 35 R⁵ Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl, oder
 für den Fall, daß X für NR^a steht, zusätzlich Wasserstoff.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren und Zwischenprodukte zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen.

Aus der WO-A 93/15,046 sind 2-[Pyrazolyl-4-oxymethylen]-anilide zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und Schadpilzen bekannt.

Der vorliegenden Erfindung lagen Verbindungen mit verbesserter Wirkung als Aufgabe zugrunde.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden. Des weiteren wurden Verfahren und Zwischenprodukte zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mischungen sowie Verfahren zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen und Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

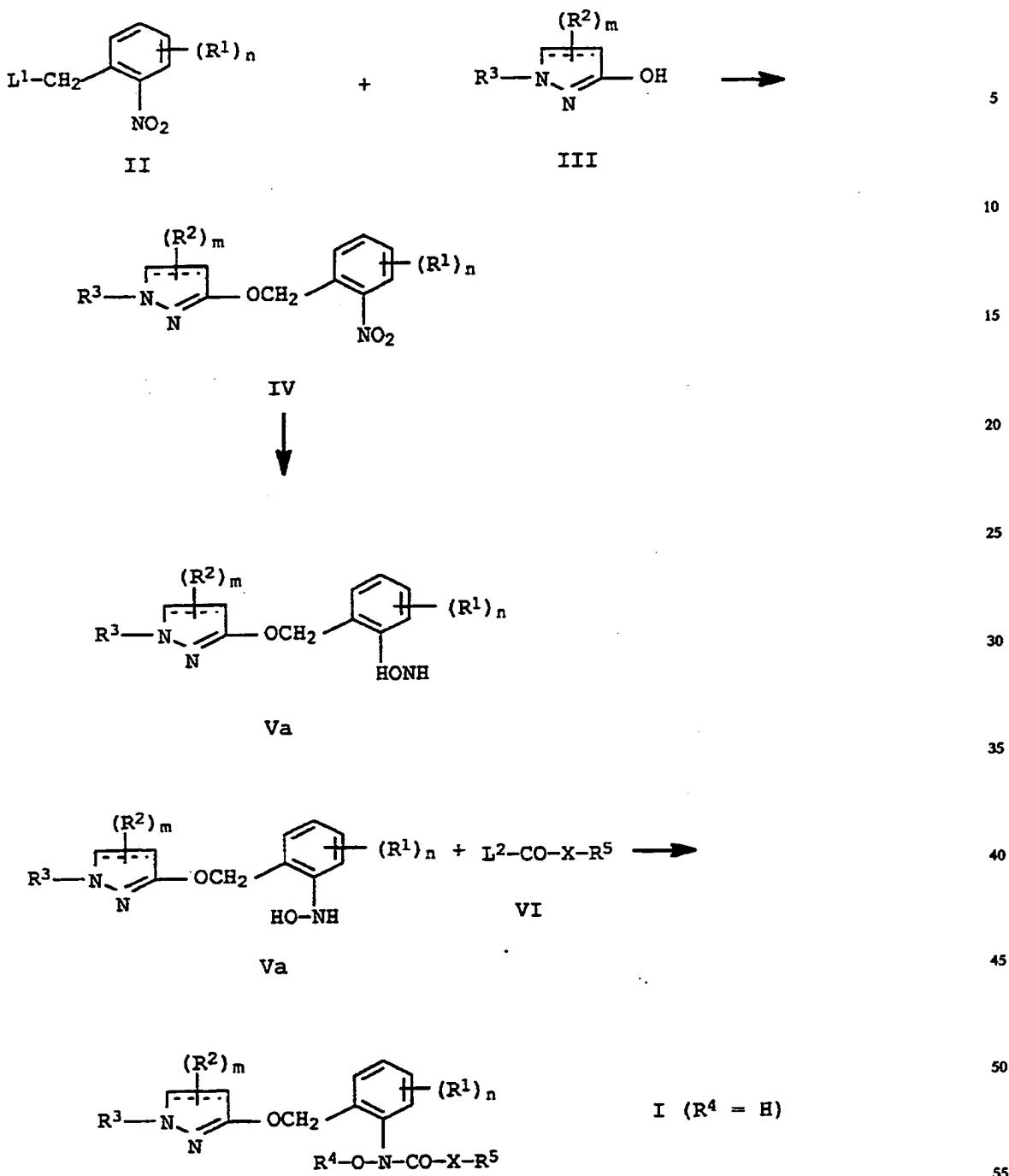
45 Die Verbindungen I sind auf verschiedenen Wegen erhältlich.

Man erhält diejenigen Verbindungen I, in denen R⁴ Wasserstoff bedeutet, und X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, beispielsweise dadurch, daß man ein Benzyllderivat der Formel II in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxy(dihydro)pyrazol der Formel III in das entsprechende 2-[(Dihydro)pyrazolyl-3-oxymethylen]-nitrobenzol der Formel IV überführt, IV anschließend zum N-Hydroxylanilin der Formel Va reduziert und
 50 Va mit einer Carbonylverbindung der Formel VI in I umwandelt.

55

60

65



L¹ in der Formel II und L² in der Formel VI bedeuten jeweils eine nucleophil austauschbare Gruppe, beispielsweise Halogen (z. B. Chlor, Brom und Iod), oder ein Alkyl oder Arylsulfonat (z. B. Methylsulfonat, Trifluormethylsulfonat, Phenylsulfonat und 4-Methylphenylsulfonat).

Die Veretherung der Verbindungen II und III wird üblicherweise bei Temperaturen von 0°C bis 80°C, vorzugsweise 20°C bis 60°C, durchgeführt.

Geeignete Lösungsmittel sind aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylo, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, i-Propanol, n-Butanol und tert-Butanol, Ketone wie Aceton und Methylketon sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid, Dimethylacetamid, 1,3-Dimethylimidazolidin-2-on und 1,2-Dimethyltetrahydro-2(1H)-pyrimidin, vorzugsweise Methylenechlorid, Aceton, Toluol, Methyltert-butylether und Dimethylformamid. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet

werden.

Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide (z. B. Lithiumhydroxid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid und Calciumhydroxid), Alkalimetall- und Erdalkalimetalloxide (z. B. Lithiumoxid, Natriumoxid, Calciumoxid und Magnesiumoxid), Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride (z. B. Lithiumhydrid, Natriumhydrid, Kaliumhydrid und Calciumhydrid), Alkalimetallamide (z. B. Lithiumamid, Natriumamid und Kaliumamid), Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate (z. B. Lithiumcarbonat und Calciumcarbonat) sowie Alkalimetallhydrogencarbonate (z. B. Natriumhydrogencarbonat), metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle (z. B. wie Methylolithium, Butyllithium und Phenyllithium), Alkylmagnesiumhalogenide (z. B. Methylmagnesiumchlorid) sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate (z. B. Natriummethanolat, Natriummethanolat, Kaliummethanolat, Kalium-tert.-Butanolat und Dimethoxymagnesium), außerdem organische Basen, z. B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin und N-Methylpiperidin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht.

Besonders bevorzugt werden Natriumhydroxid, Kaliumcarbonat und Kalium-tert.-butanolat.

Die Basen werden im allgemeinen äquimolar, im Überschuß oder gegebenenfalls als Lösungsmittel verwendet.

Es kann für die Umsetzung vorteilhaft sein, eine katalytische Menge eines Kronenethers (z. B. 18-Krone-6 oder 15-Krone-5) zuzusetzen.

Die Umsetzung kann auch in Zweiphasensystemen bestehend aus einer Lösung von Alkali- oder Erdalkalihydroxiden oder -carbonaten in Wasser und einer organischen Phase (z. B. aromatische und/oder halogenierte Kohlenwasserstoffe) durchgeführt werden. Als Phasentransferkatalysatoren kommen hierbei beispielsweise Ammoniumhalogenide und -tetrafluoroborate (z. B. Benzyltriethylammoniumchlorid, Benzyltributylammoniumbromid, Tetrabutyl-ammoniumchlorid, Hexadecyltrimethylammoniumbromid oder Terabutylammoniumtetrafluoroborat) sowie Phosphoniumhalogenide (z. B. Tetrabutylphosphoniumchlorid und Tetraphenylphosphoniumbromid) in Betracht.

Es kann für die Umsetzung vorteilhaft sein, zunächst das 3-Hydroxy(dihydro)pyrazol mit der Base in das entsprechende Hydroxylat umzusetzen, welches dann mit dem Benzylderivat umgesetzt wird.

Die für die Herstellung der Verbindungen I benötigten Ausgangsstoffe II sind aus EP-A 513 580 bekannt oder können nach den dort beschriebenen Methoden hergestellt werden [Synthesis 1991, 181; Anal. Chim. Acta 185, 295 (1986); EP-A 336 567].

3-Hydroxypyrazole IIIa und 3-Hydroxydihydropyrazole IIIb sind ebenfalls aus der Literatur bekannt oder können nach den dort beschriebenen Methoden hergestellt werden [IIIa: J. Heterocycl. Chem. 30, 49 (1993), Chem. Ber. 107, 1318 (1974), Chem. Pharm. Bull. 19, 1389 (1971), Tetrahedron Lett. 11, 875 (1970) Chem. Heterocycl. Comp. 5, 527 (1969), Chem. Ber. 102, 3260 (1969), Chem. Ber. 109, 261 (1976), J. Org. Chem. 31, 1538 (1966), Tetrahedron 43, 607 (1987); IIIb: J. Med. Chem. 19, 715 (1976)].

Besonders vorteilhaft erhält man die 3-Hydroxypyrazole IIIa nach dem in der früheren Anmeldung DE Anm. Nr. 4 15 484.4 beschriebenen Verfahren.

Die Reduktion der Nitroverbindungen IV zu den entsprechenden N-Hydroxyanilinen Va erfolgt analog zu literaturbekannten Methoden beispielsweise mit Metallen wie Zink [vgl. Ann. Chem. 316, 278 (1901)] oder mit Wasserstoff (vgl. EP-A 085 890).

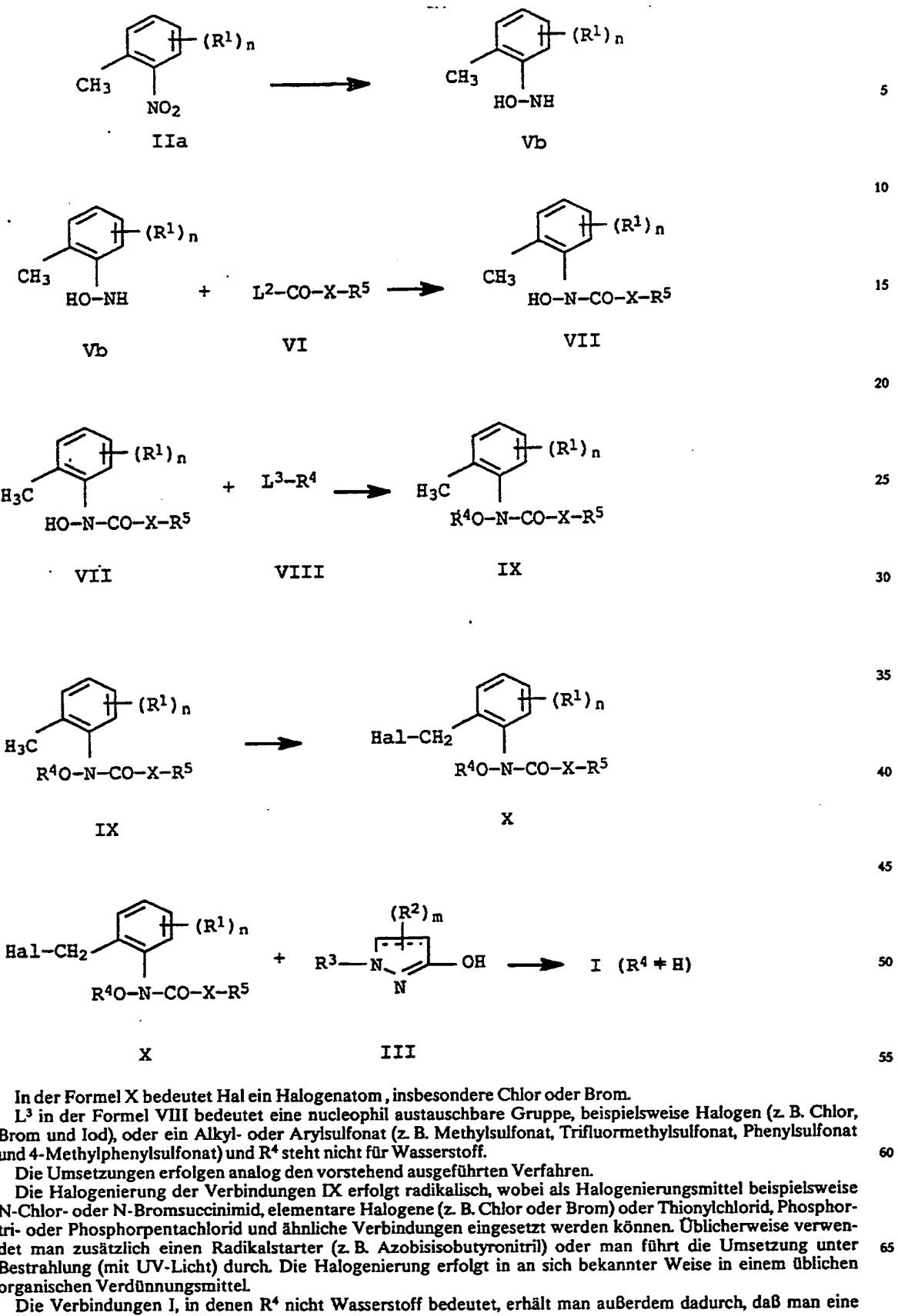
Die Umsetzung der N-Hydroxyaniline Va mit den Carbonylverbindungen VI erfolgt unter alkalischen Bedingungen gemäß den vorstehend für die Umsetzung der Verbindungen II mit den 3-Hydroxy(dihydro)pyrazolen III beschriebenen Bedingungen. Insbesondere wird die Umsetzung bei Temperaturen von –10°C bis 30°C durchgeführt. Die bevorzugten Lösungsmittel sind Methylchlorid, Toluol, tert.-Butylmethylether oder Essigsäure-ethylster. Die bevorzugten Basen sind Natriumhydrogencarbonat, Kaliumcarbonat oder wäßrige Natriumhydroxid-Lösung.

Außerdem erhält man die Verbindungen der Formel I, in denen X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, beispielsweise dadurch, daß man ein Benzylderivat der Formel IIa zunächst zum entsprechenden Hydroxyanilin der Formel Vb reduziert, Vb mit einer Carbonylverbindung der Formel VI in das entsprechende Anilid der Formel VII überführt, VII anschließend mit einer Verbindung VIII in das Amid der Formel IX überführt, IX anschließend in das entsprechende Benzylhalogenid X überführt und X in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxy(dihydro)pyrazol III in I umwandelt.

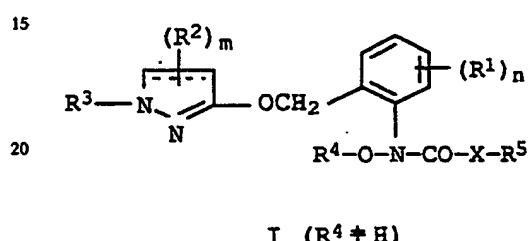
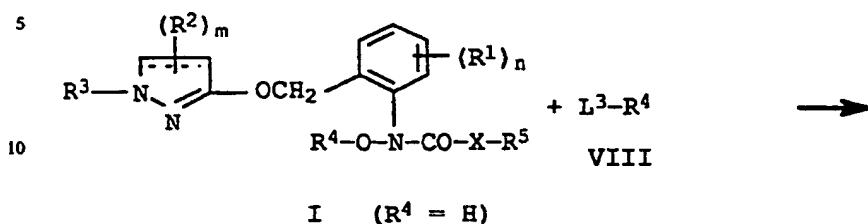
55

60

65



entsprechende Verbindung der Formel I, in der R⁴ Wasserstoff bedeutet, mit einer Verbindung der Formel VIII umsetzt.

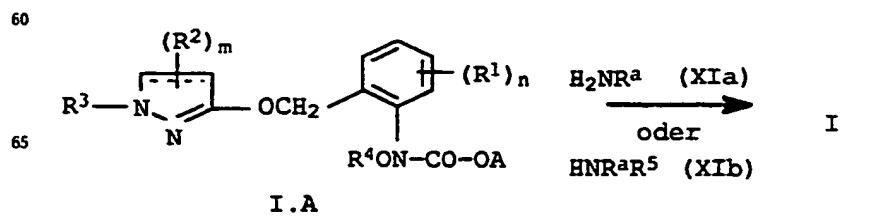
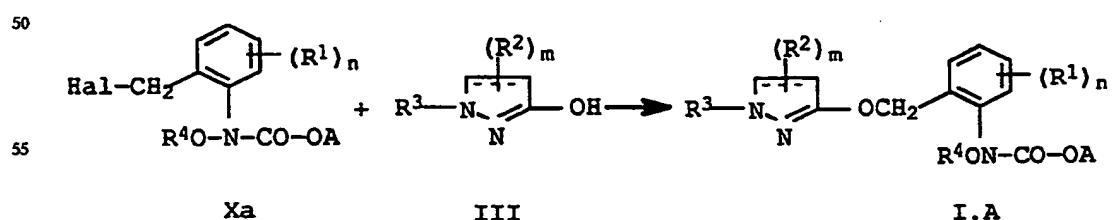
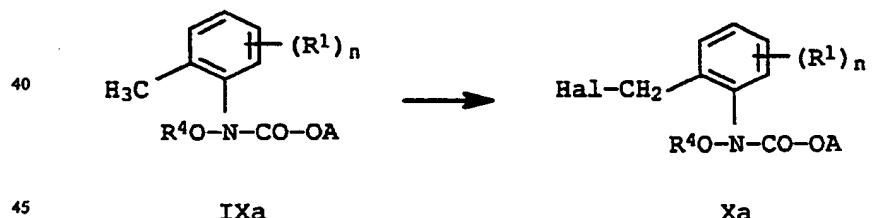


25 Die Umsetzung erfolgt in an sich bekannter Weise in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base bei Temperaturen von 0°C bis 50°C.

Als Basen dienen insbesondere Natriumhydrogencarbonat, Kaliumcarbonat, Natriumhydroxid und wäßrige Natriumhydroxid Lösungen.

30 Als Lösungsmittel finden insbesondere Aceton, Dimethylformamid, Toluol, tert.-Butylmethylether, Essigsäureethylester und Methanol Verwendung.

35 Die Verbindungen der Formel I, in denen X für NR^a steht, erhält man vorteilhaft dadurch, daß man ein Benzylanilid der Formel IXa in das entsprechende Benzylhalogenid der Formel Xa überführt, Xa in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxy(dihydro)pyrazol der Formel III in eine Verbindung der Formel IA überführt und IA anschließend mit einem primären oder sekundären Amin der Formel XI zu I umsetzt.



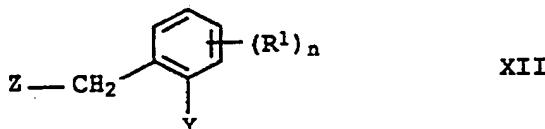
A in der Formel VIIa steht für Alkyl (insbesondere C₁–C₆-Alkyl) besondere Chlor und Brom).
Die Umsetzungen von IXa nach Xa und von Xa nach I.A erfolgen im allgemeinen und im besonderen unter den vorstehend beschriebenen Bedingungen.

Die Umsetzung der Verbindungen I.A mit den primären oder sekundären Aminen der Formel XIa bzw. XIb erfolgt bei Temperaturen von 0°C bis 100°C in einem inerten Lösungsmittel oder in einem Lösungsmittelgemisch.

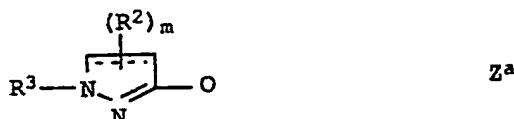
Als Lösungsmittel eignen sich insbesondere Wasser, tert.-Butylmethylether und Toluol oder deren Gemische. Es kann vorteilhaft sein, zur Verbesserung der Löslichkeit der Edukte zusätzlich eines der folgenden Lösungsmittel (als Lösungsvermittler) zuzusetzen: Tetrahydrofuran, Methanol, Dimethylformamid und Ethylenglycol.

Die Amine XIa bzw. XIb werden üblicherweise in einem Überschuß bis zu 100% bezogen auf die Verbindungen X eingesetzt oder können als Lösungsmittel verwendet werden. Es kann im Hinblick auf die Ausbeute vorteilhaft sein, die Umsetzung unter Druck durchzuführen.

Die Herstellung der Verbindungen I erfolgt über Zwischenprodukte der Formel XII



in der die Substituenten und der Index die folgende Bedeutung haben:
n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist;
R¹ Nitro, Cyano, Halogen,
ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy oder
für den Fall, daß n für 2 steht zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke,
welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2
Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie
gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;
YNO₂, NH₂OH— oder NHOR⁴
R⁴ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxy carbonyl;
Z Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Nitro, Halogen, C₁–C₆-Alkylsulfonyl, ggf. subst. Arylsulfonyl oder
eine Gruppe Z^a

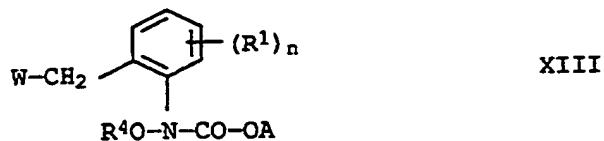


m 0, 1 oder 2, wobei die Substituenten R² verschieden sein können, wenn m größer als 1 ist;
R² Nitro, Cyano, Halogen, C₁–C₄-Alkyl, C₁–C₄-Halogenalkyl, C₁–C₄-Alkoxy, C₁–C₄-Alkylthio oder
C₁–C₄-Alkoxy carbonyl;
R³ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl oder Alkynyl;
ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis
drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder
ein ggf. subst. ein- oder zweikerniger aromatischer Rest, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stick-
stoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder
Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann.

Insbesondere sind bei der Herstellung Zwischenprodukte der Formel XII bevorzugt, in denen Y für NH₂OH und Z für die Gruppe Z^a steht.

Außerdem sind bei der Herstellung Zwischenprodukte der Formel IX bevorzugt, in denen Y für NO₂ und Z für die Gruppe Z^a steht.

Im Hinblick auf die Herstellung der Verbindungen I, in denen X für NR^a steht werden Zwischenprodukte der allgemeinen Formel XIII



bevorzugt, wobei die Substituenten R¹ und R⁴ sowie der Index n die eingangs gegebene Bedeutung haben und
die Substituenten W und A die folgende Bedeutung haben:
W Wasserstoff, Halogen oder Z^a, und

A Alkyl oder Phenyl.

Insbesondere sind hierbei Verbindungen XIII bevorzugt, bei denen der Substituenten W für Wasserstoff, Chlor, Brom oder Z^a steht.

Außerdem sind solche Verbindungen XIII bevorzugt, bei denen der Substituent A für C₁–C₆-Alkyl steht.

5 Insbesondere sind auch solche Verbindungen XIII besonders bevorzugt, in denen der Substituent A für Phenyl steht.

Gleichermaßen bevorzugt sind solche Verbindungen XIII, in denen R⁴ für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht.

Daneben werden Verbindungen XIII bevorzugt, in denen n für 0 oder 1 steht.

10 Besonders bevorzugt sind solche Verbindungen XIII, in denen die Substituenten und der Index die folgende Bedeutung haben:

n 0,

W Wasserstoff, Chlor, Brom oder Z^a,

R⁴ Wasserstoff, Methyl oder Ethyl und

15 A Phenyl.

Die Verbindungen I können saure oder basische Zentren enthalten und dementsprechend Säureadditionsprodukte oder Basenadditionsprodukte oder Salze bilden.

Säuren für Säureadditionsprodukte sind u. a. Mineralsäuren (z. B. Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoff- und Bromwasserstoffsäure, Phosphorsäure, Schwefelsäure, Salpetersäure), organische Säuren (z. B. 20 Ameisensäure, Essigsäure, Oxalsäure, Malonsäure, Milchsäure, Äpfelsäure, Bernsteinsäure, Weinsäure, Zitronensäure, Salizylsäure, p-Toluolsulfonsäure, Dodecylbenzolsulfonsäure) oder andere protonenacide Verbindungen (z. B. Saccharin).

25 Basen für Basenadditionsprodukte sind u. a. Oxide, Hydroxide, Carbonate oder Hydrogencarbonate von Alkalimetallen oder Erdalkalimetallen (z. B. Kalium- oder Natriumhydroxyd oder -carbonat) oder Ammoniumverbindungen (z. B. Ammoniumhydroxyd).

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden z. T. Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

30 Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4 oder 10 Kohlenstoffatomen, z. B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl und 1,1-Dimethylethyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei diese in Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z. B. C₁–C₂-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl und Pentafluorethyl;

35 Alkylcarbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen, insbesondere mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (–CO–) an das Gerüst gebunden sind;

Alkoxy: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 oder 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend 40 genannt), welche über ein Sauerstoffatom (–O–) an das Gerüst gebunden sind;

Alkoxy carbonyl: geradkettige oder verzweigte Alkoxygruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über eine Carbonylgruppe (–CO–) an das Gerüst gebunden sind;

Alkylthio: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Schwefelatom (–S–) an das Gerüst gebunden sind;

45 ggf. subst. Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste, insbesondere mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen, z. B. C₁–C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Petyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 50 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

ggf. subst. Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste, insbesondere mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position, z. B. C₂–C₆-Alkenyl wie Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl, 1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl, 3-Methyl-1-but enyl, 1-Methyl-2-but enyl, 2-Methyl-2-but enyl, 3-Methyl-2-but enyl, 1-Methyl-3-but enyl, 2-Methyl-3-but enyl, 3-Methyl-3-but enyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl, 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl, 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl, 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl, 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1,1-Dimethyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-but enyl, 1,2-Dimethyl-2-but enyl, 1,2-Dimethyl-3-but enyl, 1,3-Dimethyl-1-but enyl, 1,3-Dimethyl-2-but enyl, 1,3-Dimethyl-3-but enyl, 2,2-Dimethyl-3-but enyl, 2,3-Dimethyl-1-but enyl, 2,3-Dimethyl-2-but enyl, 2,3-Dimethyl-3-but enyl, 65 3,3-Dimethyl-1-but enyl, 3,3-Dimethyl-2-but enyl, 1-Ethyl-1-but enyl, 1-Ethyl-2-but enyl, 1-Ethyl-3-but enyl, 2-Ethyl-1-but enyl, 2-Ethyl-2-but enyl, 2-Ethyl-3-but enyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, ggf. subst. Alkenyloxy: geradkettige oder verzweigte Alkenylgruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie

vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom ($-O-$) an das Gerüst gebunden sind;
 Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen, insbesondere mit 2 bis 20 Kohlenstoffatomen und einer Dreifachbindung in einer beliebigen Position, z. B. C_2-C_6 -Alkinyl wie Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl, 1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Di-methyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;
 ggf. subst. Alkinyloxy: geradkettige oder verzweigte Alkinylgruppen mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), welche über ein Sauerstoffatom ($-O-$) an das Gerüst gebunden sind;
 ggf. subst. Cycloalkyl: mono- oder bicyclische Kohlenwasserstoffreste mit 3 bis 10 Kohlenstoffatomen, z. B. C_3-C_{10} -(Bi)cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Bornanyl, Norbornanyl, Dicyclohexyl, Bicyclo[3,3,0]octyl, Bicyclo[3,2,1]octyl, Bicyclo[2,2,2]octyl oder Bicyclo[3,3,1]nonyl;
 ggf. subst. Cycloalkenyl: mono- oder bicyclische Kohlenwasserstoffreste mit 5 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Ringposition, z. B. C_5-C_{10} -(Bi)cycloalkenyl wie Cyclopentenyl, Cyclohexenyl, Cycloheptenyl, Bornenyl, Norbornenyl, Dicyclohexenyl und Bicyclo[3,3,0]octenyl, eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2-Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann: Brücken, die mit dem Ring, an den sie gebunden sind beispielsweise eines der folgenden Systeme bilden: Chinolinyl, Benzofuranyl und Naphthyl;
 ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, beispielsweise Carbocyclen wie Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopent-2-enyl, Cyclohex-2-enyl, 5-bis 6-gliedrige, gesättigte oder ungesättigte Heterocyclen, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl, 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl, 2,4-Dihydrofuran-2-yl, 2,4-Dihydrofuran-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2,3-Pyrrolin-2-yl, 2,3-Pyrrolin-3-yl, 2,4-Pyrrolin-2-yl, 2,4-Pyrrolin-3-yl, 2,3-Isoxazolin-3-yl, 3,4-Isoxazolin-3-yl, 4,5-Isoxazolin-3-yl, 2,3-Isoxazolin-4-yl, 3,4-Isoxazolin-4-yl, 4,5-Isoxazolin-4-yl, 2,3-Isoxazolin-5-yl, 3,4-Isoxazolin-5-yl, 4,5-Isoxazolin-5-yl, 2,3-Isothiazolin-3-yl, 3,4-Isothiazolin-3-yl, 4,5-Isothiazolin-3-yl, 2,3-Isothiazolin-4-yl, 3,4-Isothiazolin-4-yl, 4,5-Isothiazolin-4-yl, 2,3-Isothiazolin-5-yl, 3,4-Isothiazolin-5-yl, 4,5-Isothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydropyridazinyl, 4-Tetrahydropyridazinyl, 2-Tetrahydropyrimidinyl, 4-Tetrahydropyrimidinyl, 5-Tetrahydropyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrazinyl, 1,3,5-Tetrahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Tetrahydrotetraazin-3-yl, vorzugsweise 2-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 1,3,4-Oxazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 4,5-Isoxazolin-3-yl, 3-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl, 4-Piperidinyl, 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl; oder ein ggf. subst. ein- oder zweikerniges aromatisches Ringsystem, welches neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann, d. h. Arylreste wie Phenyl und Naphthyl, vorzugsweise Phenyl oder 1- oder 2-Naphthyl, und Hetarylreste, beispielsweise 5-Ring Heteroaromatene enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 1-Pyrrolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 1-Pyrazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 1-Imidazolyl, 2-Imidazo-yl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,5-Triazol-3-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 5-Tetrazolyl, 1,2,3,4-Thiatriazol-5-yl und 1,2,3,4-Oxatriazol-5-yl, insbesondere 3-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 4-Oxazolyl, 4-Thiazolyl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl und 1,3,4-Thiadiazol-2-yl; sechsring Heteroaromatene enthaltend ein bis vier Stickstoffatome als Heteroatome wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Tetraazin-3-yl und 1,2,4,5-Tetraazin-3-yl, insbesondere 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl und 4-Pyridazinyl.

Der Zusatz „ggf. subst.“ in bezug auf Alkyl-, Alkenyl- und Alkinylgruppen soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können (d. h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt (vorzugswei-

se Fluor, Chlor und Brom, insbesondere Fluor und Chlor) ersetzt sein können und/oder einen bis drei, insbesondere einen, der folgenden Reste tragen können:

5 C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Halogenalkoxy, C_1-C_6 -Alkythio, C_1-C_6 -Halogenalkylthio, C_1-C_6 -Alkylamino, Di- C_1-C_6 -alkylamino, C_2-C_6 -Alkenyloxy, C_2-C_6 -Halogenalkenyloxy, C_2-C_6 -Alkinyloxy, C_2-C_6 -Halogenalkenyloxy, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_3-C_6 -Cycloalkyloxy, C_3-C_6 -Cycloalkenyl, C_3-C_6 -Cycloalkenyloxy, oder ein ggf. subst. ein- oder zweikerniges aromatisches Ringsystem, welches neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann (wie vorstehend genannt), welches direkt oder über ein Sauerstoffatom ($-O-$), ein Schwefelatom ($-S-$) oder eine Aminogruppe ($-NR^a-$) an den Substituenten gebunden sein kann, d. h. Arylreste wie Phenyl und Naphthyl, vorzugsweise Phenyl oder 1- oder 2-Naphthyl, und Hetarylreste, beispielsweise 5-Ring Heteroaromatene enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 1-Pyrrolyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 1-Pyrazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 1-Imidazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,2,5-Triazol-3-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,3-Triazol-4-yl, 5-Tetrazolyl, 1,2,3,4-Thiatriazol-5-yl und 1,2,3,4-Oxatriazol-5-yl, insbesondere 3-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 4-Oxazolyl, 4-Thiazolyl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl und 1,3,4-Thiadiazol-2-yl;

10 Sechsring Heteroaromatene enthaltend ein bis vier Stickstoffatome als Heteroatome wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl und 1,2,4,5-Tetrazin-3-yl, insbesondere 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl und 4-Pyridazinyl.

15 Der Zusatz "ggf. subst" in bezug auf die cyclischen (gesättigten, ungesättigten oder aromatischen) Gruppen soll zum Ausdruck bringen, daß diese Gruppen partiell oder vollständig halogeniert sein können (d. h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können teilweise oder vollständig durch gleiche oder verschiedene Halogenatome wie vorstehend genannt (vorzugsweise Fluor, Chlor und Brom, insbesondere Fluor und Chlor) ersetzt sein können und/oder einen bis drei, der folgenden Reste tragen können:

20 Die bei den Resten genannten ein- oder zweikernigen aromatischen oder heteroaromatischen Systeme können ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein, d. h. die Wasserstoffatome dieser Gruppen können partiell oder vollständig durch Halogenatome wie Fluor, Chlor, Brom und Jod, vorzugsweise Fluor und Chlor ersetzt sein.

25 Diese ein- oder zweikernigen aromatischen oder heteroaromatischen Systeme können neben den bezeichneten Halogenatomen ein bis drei der folgenden Substituenten tragen:

Nitro;

30 Cyano, Thiocyanato;

35 Alkyl, besonders C_1-C_6 -Alkyl wie vorstehend genannt, vorzugsweise Methyl, Ethyl, 1-Methylethyl, 1,1-Dimethylethyl, Butyl, Hexyl, insbesondere Methyl und 1-Methylethyl;

C_1-C_4 -Halogenalkyl, wie vorstehend genannt, vorzugsweise Trichlormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl und Pentafluorethyl;

40 C_1-C_4 -Alkoxy, vorzugsweise Methoxy, Ethoxy, 1-Methylethoxy und 1,1-Dimethylethoxy, insbesondere Methoxy;

C_1-C_4 -Halogenalkoxy, besonders C_1-C_2 -Halogenalkoxy, vorzugsweise Difluormethyloxy, Trifluormethyloxy und 2,2,2-Trifluorethyoxy, insbesondere Difluormethyloxy;

C_1-C_4 -Alkythio, vorzugsweise Methylthio und 1-Methylethylthio, insbesondere Methylthio;

45 C_1-C_4 -Alkylamino wie Methylamino, Ethylamino, Propylamino, 1-Methylethylamino, Butylamino, 1-Methylpropylamino, 2-Methylpropylamino und 1,1-Dimethylethylamino, vorzugsweise Methylamino und 1,1-Dimethylethylamino, insbesondere Methylamino,

50 Di- C_1-C_4 -alkylamino wie N,N-Dimethylamino, N,N-Diethylamino, N,N-Diisopropylamino, N,N-Di-(1-methylethyl)amino, N,N-Dibutylamino, N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)amino, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)amino, N-Ethyl-N-methylamino, N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino,

55 N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino, N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino, N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino, N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)amino, N-(1,1-Diisopropylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino und N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino, vorzugsweise N,N-Dimethylamino und

60 N,N-Diethylamino, insbesondere N,N-Dimethylamino;

C_1-C_6 -Alkylcarbonyl wie Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, Propylcarbonyl, 1-Methylethyl-carbonyl, Butylcarbonyl, 1-Methylpropylcarbonyl, 2-Methylpropylcarbonyl, 1,1-Dimethylethylcarbonyl, Pentylcarbonyl, 1-Methylbutylcarbonyl, 2-Methylbutylcarbonyl, 3-Methylbutylcarbonyl, 1,1-Dimethylpropylcarbonyl, 1,2-Dimethylpropylcarbonyl, 2,2-Diisopropylcarbonyl, 1-Ethylpropylcarbonyl, Hexylcarbonyl, 1-Methylpentylcarbonyl, 2-Methylpentylcarbonyl, 3-Methylpentylcarbonyl, 4-Methylpentylcarbonyl, 1,1-Dimethylbutylcarbonyl, 1,2-Dimethylbutylcarbonyl, 1,3-Dimethylbutylcarbonyl, 2,2-Dimethylbutylcarbonyl, 2,3-Dimethylbutylcarbonyl, 3,3-Dimethylbutylcarbonyl, 1-Ethylbutylcarbonyl, 2-Ethylbutylcarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylcarbonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylcarbonyl, vorzugsweise Methylcarbo-

nyl, Ethylcarbonyl und 1,1-Dimethylcarbonyl, insbesondere Ethylcarbonyl;
 C₁—C₆-Alkoxy carbonyl wie Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propyloxycarbonyl, 1-Methyl-ethoxycarbonyl, Butyloxycarbonyl, 1-Methylpropyloxycarbonyl, 2-Methylpropyloxycarbonyl, 1,1-Dimethylmethoxy carbonyl, Pentyloxycarbonyl, 1-Methylbutyloxycarbonyl, 2-Methyl butyloxycarbonyl, 3-Methylbutyloxycarbonyl, 2,2-Dimethylpropyloxycarbonyl, 1-Ethylpropyloxycarbonyl, Hexyloxycarbonyl, 1,1-Dimethylpropyloxycarbonyl, 1,2-Dimethylpropyloxycarbonyl, 4-Methylpentyloxycarbonyl, 1,1-Dimethylbutyloxycarbonyl, 1-Ethylpentyloxycarbonyl, 2-Methylpentyloxycarbonyl, 3-Methylpentyloxycarbonyl, 1,2-Dimethylbutyloxycarbonyl, 2,2-Dimethylbutyloxycarbonyl, 2,3-Dimethylbutyloxycarbonyl, 3,3-Dimethylbutyloxycarbonyl, 1-Ethylbutyloxycarbonyl, 2-Ethylbutyloxycarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropyloxycarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropyloxycarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropyloxycarbonyl und 1-Ethyl-2-methylpropyloxycarbonyl, vorzugsweise Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl und 1,1-Dimethylmethoxy carbonyl, insbesondere Ethoxycarbonyl;
 C₁—C₆-Alkylaminocarbonyl wie Methylaminocarbonyl, Ethylaminocarbonyl, Propylaminocarbonyl, 1-Methylaminocarbonyl, Butylaminocarbonyl, 1-Methylpropylaminocarbonyl, 2-Methylpropylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylaminocarbonyl, Pentylamino carbonyl, 1-Methylbutylaminocarbonyl, 2-Methylbutylaminocarbonyl, 3-Methylbutylaminocarbonyl, 2,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Ethylpropylaminocarbonyl, Hexylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Methylpentylamino carbonyl, 2-Methylpentylamino carbonyl, 3-Methylpentylamino carbonyl, 4-Methylpentylamino carbonyl, 1,1-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 2,2-Dimethylbutylaminocarbonyl, 2,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 3,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1-Ethylbutylaminocarbonyl, 2-Ethylbutylaminocarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropylaminocarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylaminocarbonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylaminocarbonyl und 1-Ethyl-2-methylpropylaminocarbonyl, vorzugsweise Methylaminocarbonyl und Ethylaminocarbonyl, insbesondere Methylaminocarbonyl;
 Di-C₁—C₆-alkylaminocarbonyl, besonders Di-C₁—C₄-alkylaminocarbonyl wie N,N-Dimethylaminocarbonyl, N,N-Diethylaminocarbonyl, N,N-Di-propylaminocarbonyl, N,N-Di-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N,N-Di-butylaminocarbonyl, N,N-Di-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N,N-Di-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-methylaminocarbonyl, N-Methyl-N-propylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-methylaminocarbonyl, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Methyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminocarbonyl, N-Ethyl N-propylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl N-ethylaminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-propylaminocarbonyl, N-Butyl N-propylaminocarbonyl, N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl, N-Butyl-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)aminocarbonyl und N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)aminocarbonyl, vorzugsweise N,N-Dimethylaminocarbonyl und N,N-Diethylaminocarbonyl, insbesondere N,N-Dimethylaminocarbonyl;
 C₁—C₆-Alkylcarboxyl wie Methylcarboxyl, Ethylcarboxyl, Propylcarboxyl, 1-Methyl-ethyl-carboxyl, Butylcarboxyl, 1-Methylpropylcarboxyl, 2-Methylpropylcarboxyl, 1,1-Dimethyl-ethylcarboxyl, Pentylcarboxyl, 1-Methylbutylcarboxyl, 2-Methylbutylcarboxyl, 3-Methylbutylcarboxyl, 1,1-Dimethylpropylcarboxyl, 1,2-Dimethylpropylcarboxyl, 2,2-Dimethylpropylcarboxyl, 1-Ethylpropylcarboxyl, Hexylcarboxyl, 1-Methylpentylcarboxyl, 2-Methylpentylcarboxyl, 3-Methylpentylcarboxyl, 4-Methylpentylcarboxyl, 1,2-Dimethylbutylcarboxyl, 1,3-Dimethylbutylcarboxyl, 2,2-Dimethylbutylcarboxyl, 2,3-Dimethylbutylcarboxyl, 3,3-Dimethylbutylcarboxyl, 1-Ethylbutylcarboxyl, 2-Ethylbutylcarboxyl, 1,1,2-Trimethylpropylcarboxyl, 1,2,2-Trimethylpropylcarboxyl, 1-Ethyl-1-methylpropylcarboxyl und 1-Ethyl-2-methylpropylcarboxyl, vorzugsweise Methylcarboxyl, Ethylcarboxyl und 1,1-Dimethylmethylethylcarbonyl, insbesondere Methylcarboxyl und 1,1-Dimethylmethylethylcarboxyl;
 C₁—C₆-Alkylcarbonylamino wie Methylcarbonylamino, Ethylcarbonylamino, Propylcarbonylamino, 1-Methylcarbonylamino, Butylcarbonylamino, 1-Methylpropylcarbonylamino, 2-Methylpropylcarbonylamino, 1,1-Dimethyl-ethylcarbonylamino, Pentycarbonylamino, 1-Methylbutylcarbonylamino, 2-Methylbutylcarbonylamino, 3-Methylbutylcarbonylamino, 2,2-Dimethylpropylcarbonylamino, 1-Ethylpropylcarbonylamino, Hexylcarbonylamino, 1,1-Dimethylpropylcarbonylamino, 1,2-Dimethylpropylcarbonylamino, 1-Methylpentylcarbonylamino, 2-Methylpentylcarbonylamino, 3-Methylpentylcarbonylamino, 4-Methylpentylcarbonylamino, 1,1-Dimethylbutylcarbonylamino, 1,2-Dimethylbutylcarbonylamino, 1,3-Dimethylbutylcarbonylamino, 2,2-Dimethylbutylcarbonylamino, 2,3-Dimethylbutylcarbonylamino, 3,3-Dimethylbutylcarbonylamino, 1-Ethylbutylcarbonylamino, 2-Ethylbutylcarbonylamino, 1,1,2-Trimethylpropylcarbonylamino, 1,2,2-Trimethylpropylcarbonylamino, 1-Ethyl-1-methylpropylcarbonylamino und 1-Ethyl-2-methylpropylcarbonylamino, vorzugsweise Methylcarbonylamino und Ethylcarbonylamino, insbesondere Ethylcarbonylamino;
 C₃—C₇-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl und Cycloheptyl, vorzugsweise Cyclopropyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl, insbesondere Cyclopropyl;
 C₃—C₇-Cycloalkoxy wie Cyclopropyloxy, Cyclobutyloxy, Cyclopentyloxy, Cyclohexyloxy und Cycloheptyloxy, vorzugsweise Cyclopentyloxy und Cyclohexyloxy, insbesondere Cyclohexyloxy;
 C₃—C₇-Cycloalkylthio wie Cyclopropylthio, Cyclobutylthio, Cyclopentylthio, Cyclohexylthio und Cycloheptylthio, vorzugsweise Cyclohexylthio;
 C₃—C₇-Cycloalkylamino wie Cyclopropylamino, Cyclobutylamino, Cyclopentylamino, Cyclohexylamino und Cycloheptyl amino, vorzugsweise Cyclopropylamino und Cyclohexylamino, insbesondere Cyclopropylamino;

Die ein- oder zweikernigen aromatischen oder heteroaromatischen Systeme können neben den vorstehend genannten Substituenten auch einen Rest $-\text{CR}'=\text{NOR}''$ tragen, wobei die Reste R' und R'' für die folgenden Gruppen stehen:

5 R' Wasserstoff, Cyano, Alkyl (vorzugsweise C_1-C_6 -Alkyl, insbesondere C_1-C_4 -Alkyl), Haloalkyl (vorzugsweise C_1-C_4 -Haloalkyl, insbesondere C_1-C_2 -Haloalkyl), Alkenyl (vorzugsweise C_2-C_6 -Alkenyl, insbesondere C_2-C_4 -Alkenyl), Haloalkenyl (vorzugsweise C_2-C_6 -Haloalkenyl, insbesondere C_2-C_4 -Haloalkenyl), Alkinyl (vorzugsweise C_2-C_6 -Alkinyl, insbesondere C_2-C_4 -Alkinyl), Haloalkinyl (vorzugsweise C_2-C_6 -Haloalkinyl, insbesondere C_2-C_4 -Haloalkinyl) und Cycloalkyl (vorzugsweise C_3-C_8 -Cycloalkyl, insbesondere C_3-C_6 -Cycloalkyl);

10 R'' Alkyl (vorzugsweise C_1-C_6 -Alkyl, insbesondere C_1-C_4 -Alkyl), Haloalkyl (vorzugsweise C_1-C_4 -Haloalkyl, insbesondere C_1-C_2 -Haloalkyl), Alkenyl (vorzugsweise C_2-C_6 -Alkenyl, insbesondere C_2-C_4 -Alkenyl), Haloalkenyl (vorzugsweise C_2-C_6 -Haloalkenyl, insbesondere C_2-C_4 -Haloalkenyl), Alkinyl (vorzugsweise C_2-C_6 -Alkinyl, insbesondere C_2-C_4 -Alkinyl), Haloalkinyl (vorzugsweise C_2-C_6 -Haloalkinyl, insbesondere C_2-C_4 -Haloalkinyl) und Cycloalkyl (vorzugsweise C_3-C_8 -Cycloalkyl, insbesondere C_3-C_6 -Cycloalkyl).

15 Im Hinblick auf ihre biologische Wirkung sind Verbindungen I bevorzugt, in denen -- für eine Doppelbindung steht. Des Weiteren sind Verbindungen I bevorzugt, in denen -- für eine Einfachbindung steht. Gleichermaßen sind Verbindungen I bevorzugt, in denen n für 0 oder 1, insbesondere für 0, steht. Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 für Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_2 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy oder C_1-C_2 -Halogenalkoxy steht. Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen m 0 oder 1 bedeutet. Gleichermaßen werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^2 Nitro, Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy oder C_1-C_4 -Alkoxy carbonyl steht. Des Weiteren werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^3 für C_1-C_4 -Alkyl oder C_3-C_6 -Cycloalkyl steht. Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^3 für einen ggf. subst. ein- oder zweikernigen aromatischen Rest steht, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann. Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^3 für Phenyl oder Benzyl steht, wobei der Phenylrest partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder

30 — ein bis drei der folgenden Reste: Cyano, Nitro, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Halogenalkoxy, C_1-C_4 -Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_1-C_4 -Alkylcarbonyl, C_1-C_4 -Alkoxy carbonyl, Phenyl, Phenoxy und Phenyl-C₁-C₄-alkoxy, wobei die Phenylringe ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein können und/oder ein bis drei der folgenden Reste tragen können: Cyano, Nitro, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_2 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_2 -Halogenalkoxy, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_1-C_4 -Alkylcarbonyl oder C_1-C_4 -Alkoxy carbonyl, und/oder — eine Gruppe $\text{CR}'=\text{NOR}''$, in der R' Wasserstoff oder C_1-C_4 -Alkyl bedeutet und R'' für C_1-C_6 -Alkyl steht, und/oder

35 — zwei benachbarte C-Atome des Phenylrings über eine Oxy-C₁-C₃-alkoxy-Brücke oder eine Oxy-C₁-C₃-halogenalkoxy-Brücke

40 tragen kann. Außerdem werden Verbindungen I insbesondere bevorzugt, in denen R^3 für Pyridyl oder Pyrimidyl steht, wobei der Pyridylring partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder ein bis drei der folgenden Reste tragen kann: Cyano, Nitro, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_2 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_2 -Halogenalkoxy, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_1-C_4 -Alkylcarbonyl oder C_1-C_4 -Alkoxy carbonyl. Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^4 für Wasserstoff, C_1-C_4 -Alkyl oder C_1-C_2 -Halogenalkyl steht. Außerdem werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^5X für Methyl, Ethyl, Methoxy oder Methylamino steht. Beispiele für insbesondere bevorzugte Verbindungen I sind in den Tabellen zusammengestellt.

Tabelle 1

55 Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Methyl bedeutet und R^p für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht

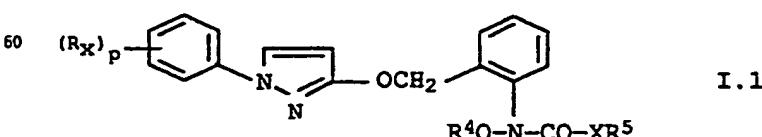


Tabelle 2

65 Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R^4 für Methyl steht, R^5X Ethyl bedeutet und R^p für eine

Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 3

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht 5

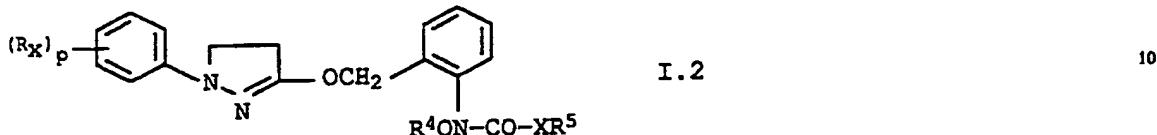


Tabelle 4

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 5

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 6

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 7

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 8

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 9

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R^y Wasserstoff bedeutet, R^z Chlor bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

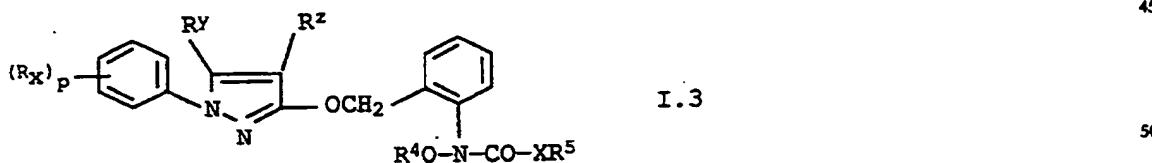


Tabelle 10

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R^y Wasserstoff bedeutet, R^z Chlor bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht. 55

Tabelle 11

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R^y Wasserstoff bedeutet, R^z Chlor bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 12

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R^y Wasserstoff bedeutet, R^z Chlor bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht. 65

Tabelle 13

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R^y Methyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

5

Tabelle 14

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R^y Methyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10

Tabelle 15

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R^y Methyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 16

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R^y Methyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 17

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methyl bedeutet, R^y Trifluormethyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 18

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R^y Trifluormethyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 19

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R^y Trifluormethyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 20

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Methyl steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R^y Trifluormethyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

40

Tabelle 21

Verbindungen der allgemeinen Formel I.4, in denen R⁵X Methyl bedeutet und die Kombination der Substituenten R¹, R^y, R^z, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht

45

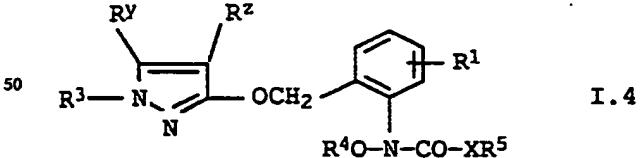


Tabelle 22

Verbindungen der allgemeinen Formel I.4, in denen R⁵X Ethyl bedeutet und die Kombination der Substituenten R¹, R^y, R^z, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht.

60

Tabelle 23

Verbindungen der allgemeinen Formel I.4, in denen R⁵X Methoxy bedeutet und die Kombination der Substituenten R¹, R^y, R^z, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht.

65

Tabelle 24

Verbindungen der allgemeinen Formel I.4, in denen R⁵X Methylamino bedeutet und die Kombination der Substituenten R¹, R^y, R^z, R³ und R⁴ für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entspricht.

Tabelle 25

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methyl bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

5

Tabelle 26

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Ethyl bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

10

Tabelle 27

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methyl bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

15

Tabelle 28

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Ethyl bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

20

Tabelle 29

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methoxy bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

25

Tabelle 30

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methoxy bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

30

Tabelle 31

Verbindungen der allgemeinen Formel I.1, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methylamino bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

Tabelle 32

Verbindungen der allgemeinen Formel I.2, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methylamino bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

40

Tabelle 33

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methyl bedeutet, R^y Wasserstoff bedeutet, R^z Chlor bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

45

Tabelle 34

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R^y Wasserstoff bedeutet, R^z Chlor bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

50

Tabelle 35

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methoxy bedeutet, R^y Wasserstoff bedeutet, R^z Chlor bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

55

Tabelle 36

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methylamino bedeutet, R^y Wasserstoff bedeutet, R^z Chlor bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

60

Tabelle 37

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Methyl bedeutet, R^y Methyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

65

Tabelle 38

Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R⁴ für Wasserstoff steht, R⁵X Ethyl bedeutet, R^y Methyl

DE 44 23 612 A1

bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 39

5 Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methoxy bedeutet, R^y Methyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 40

10 Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methylamino bedeutet, R^y Methyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 41

15 Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methyl bedeutet, R^y Trifluormethyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 42

20 Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Ethyl bedeutet, R^y Trifluormethyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 43

25 Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methoxy bedeutet, R^y Trifluormethyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

Tabelle 44

30 Verbindungen der allgemeinen Formel I.3, in denen R^4 für Wasserstoff steht, R^5X Methylamino bedeutet, R^y Trifluormethyl bedeutet, R^z Wasserstoff bedeutet und R^{x_p} für eine Verbindung einer Zeile der Tabelle A entspricht.

35

40

45

50

55

60

65

Tabelle A

| Nummer | R_x^p | |
|--------|--------------------------|----|
| 1 | H | 5 |
| 2 | 2-F | |
| 3 | 3-F | 10 |
| 4 | 4-F | |
| 5 | 2,4-F ₂ | |
| 6 | 2,4,6-F ₃ | 15 |
| 7 | 2,3,4,5,6-F ₅ | |
| 8 | 2,3-F ₂ | |
| 9 | 2-Cl | 20 |
| 10 | 3-Cl | |
| 11 | 4-Cl | |
| 12 | 2,3-Cl ₂ | 25 |
| 13 | 2,4-Cl ₂ | |
| 14 | 2,5-Cl ₂ | |
| 15 | 2,6-Cl ₂ | 30 |
| 16 | 3,4-Cl ₂ | |
| 17 | 3,5-Cl ₂ | |
| 18 | 2,3,4-Cl ₃ | 35 |
| 19 | 2,3,5-Cl ₃ | |
| 11 | 2,3,6-Cl ₃ | |
| 12 | 2,4,5-Cl ₃ | 40 |
| 13 | 2,4,6-Cl ₃ | |
| 14 | 3,4,5-Cl ₃ | |
| 15 | 2,3,4,6-Cl ₄ | 45 |
| 16 | 2,3,5,6-Cl ₄ | |

50

55

60

65

| Nummer | R ^x _P |
|--------|-----------------------------|
| 17 | 2,3,4,5,6-Cl ₅ |
| 18 | 2-Br |
| 19 | 3-Br |
| 20 | 4-Br |
| 21 | 2,4-Br ₂ |
| 22 | 2,5-Br ₂ |
| 23 | 2,6-Br ₂ |
| 24 | 2,4,6-Br ₃ |
| 25 | 2,3,4,5,6-Br ₅ |
| 26 | 2-J |
| 27 | 3-J |
| 28 | 4-J |
| 29 | 2,4-J ₂ |
| 30 | 2-Cl, 3-F |
| 31 | 2-Cl, 4-F |
| 32 | 2-Cl, 5-F |
| 33 | 2-Cl, 6-F |
| 34 | 2-Cl, 3-Br |
| 35 | 2-Cl, 4-Br |
| 36 | 2-Cl, 5-Br |
| 37 | 2-Cl, 6-Br |
| 38 | 2-Br, 3-Cl |
| 39 | 2-Br, 4-Cl |
| 40 | 2-Br, 5-Cl |
| 41 | 2-Br, 3-F |
| 42 | 2-Br, 4-F |
| 43 | 2-Br, 5-F |
| 44 | 2-Br, 6-F |
| 45 | 2-F, 3-Cl |
| 46 | 2-F, 4-Cl |
| 47 | 2-F, 5-Cl |
| 48 | 3-Cl, 4-F |
| 49 | 3-Cl, 5-F |
| 50 | 3-Cl, 4-Br |
| 51 | 3-Cl, 5-Br |
| 52 | 3-F, 4-Cl |
| 53 | 3-F, 4-Br |
| 54 | 3-Br, 4-Cl |
| 55 | 3-Br, 4-F |

| Nummer | R_x^p | |
|--------|---|----|
| 56 | 2, 6-Cl ₂ , 4-Br | 5 |
| 57 | 2-CH ₃ | |
| 58 | 3-CH ₃ | |
| 59 | 4-CH ₃ | |
| 60 | 2, 3-(CH ₃) ₂ | 10 |
| 61 | 2, 4-(CH ₃) ₂ | |
| 62 | 2, 5-(CH ₃) ₂ | |
| 63 | 2, 6-(CH ₃) ₂ | 15 |
| 64 | 3, 4-(CH ₃) ₂ | |
| 65 | 3, 5-(CH ₃) ₂ | |
| 66 | 2, 3, 5-(CH ₃) ₃ | 20 |
| 67 | 2, 3, 4-(CH ₃) ₃ | |
| 68 | 2, 3, 6-(CH ₃) ₃ | |
| 69 | 2, 4, 5-(CH ₃) ₃ | 25 |
| 70 | 2, 4, 6-(CH ₃) ₃ | |
| 71 | 3, 4, 5-(CH ₃) ₃ | |
| 72 | 2, 3, 4, 6-(CH ₃) ₄ | 30 |
| 73 | 2, 3, 5, 6-(CH ₃) ₄ | |
| 74 | 2, 3, 4, 5, 6-(CH ₃) ₅ | |
| 75 | 2-C ₂ H ₅ | 35 |
| 76 | 3-C ₂ H ₅ | |
| 77 | 4-C ₂ H ₅ | |
| 78 | 2, 4-(C ₂ H ₅) ₅ | 40 |
| 79 | 2, 6-(C ₂ H ₅) ₂ | |
| 80 | 3, 5-(C ₂ H ₅) ₂ | |
| 81 | 2, 4, 6-(C ₂ H ₅) ₃ | 45 |
| 82 | 2-n-C ₃ H ₇ | |
| 83 | 3-n-C ₃ H ₇ | |
| 84 | 4-n-C ₃ H ₇ | 50 |
| 85 | 2-i-C ₃ H ₇ | |
| 86 | 3-i-C ₃ H ₇ | |
| 87 | 4-i-C ₃ H ₇ | 55 |
| 88 | 2, 4-(i-C ₃ H ₇) ₂ | |
| 89 | 2, 6-(i-C ₃ H ₇) ₂ | |
| 90 | 3, 5-(i-C ₃ H ₇) ₂ | 60 |
| 91 | 2-s-C ₄ H ₉ | |
| 92 | 3-s-C ₄ H ₉ | |
| 93 | 4-s-C ₄ H ₉ | 65 |
| 94 | 2-t-C ₄ H ₉ | |

| Nummer | R ^x _p |
|--------|---|
| 5 | 95 3-t-C ₄ H ₉ |
| 10 | 96 4-t-C ₄ H ₉ |
| 15 | 97 4-n-C ₉ H ₁₉ |
| 20 | 98 2-CH ₃ , 4-t-C ₄ H ₉ |
| 25 | 99 2-CH ₃ , 6-t-C ₄ H ₉ |
| 30 | 100 2-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇ |
| 35 | 101 2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇ |
| 40 | 102 3-CH ₃ , 4-i-C ₃ H ₇ |
| 45 | 103 2-cyclo-C ₆ H ₁₁ |
| 50 | 104 3-cyclo-C ₆ H ₁₁ |
| 55 | 105 4-cyclo-C ₆ H ₁₁ |
| 60 | 106 2-Cl, 4-C ₆ H ₅ |
| 65 | 107 2-Br, 4-C ₆ H ₅ |
| | 108 2-OCH ₃ |
| | 109 3-OCH ₃ |
| | 110 4-OCH ₃ |
| | 111 2-OC ₂ H ₅ |
| | 112 3-O-C ₂ H ₅ |
| | 113 4-O-C ₂ H ₅ |
| | 114 2-O-n-C ₃ H ₇ |
| | 115 3-O-n-C ₃ H ₇ |
| | 116 4-O-n-C ₃ H ₇ |
| | 117 2-O-i-C ₃ H ₇ |
| | 118 3-O-i-C ₃ H ₇ |
| | 119 4-O-i-C ₃ H ₇ |
| | 120 2-O-n-C ₆ H ₁₃ |
| | 121 3-O-n-C ₆ H ₁₃ |
| | 122 4-O-n-C ₆ H ₁₃ |
| | 123 2-O-CH ₂ C ₆ H ₅ |
| | 124 3-O-CH ₂ C ₆ H ₅ |
| | 125 4-O-CH ₂ C ₆ H ₅ |
| | 126 2-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅ |
| | 127 4-O-(CH ₂) ₃ C ₆ H ₅ |
| | 128 2,3-(OCH ₃) ₂ |
| | 129 2,4-(OCH ₃) ₂ |
| | 130 2,5-(OCH ₃) ₂ |
| | 131 2,6-(OCH ₃) ₂ |
| | 132 3,4-(OCH ₃) ₂ |
| | 133 3,5-(OCH ₃) ₂ |

| Nummer | R ^x _p | |
|--------|--|----|
| 134 | 2-O-t-C ₄ H ₉ | |
| 135 | 3-O-t-C ₄ H ₉ | 5 |
| 136 | 4-O-t-C ₄ H ₉ | |
| 137 | 3-(3'-Cl-C ₆ H ₄) | |
| 138 | 4-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄) | 10 |
| 139 | 2-O-C ₆ H ₅ | |
| 140 | 3-O-C ₆ H ₅ | |
| 141 | 4-O-C ₆ H ₅ | 15 |
| 142 | 2-O-(2'-F-C ₆ H ₄) | |
| 143 | 3-O-(3'-Cl-C ₆ H ₄) | |
| 144 | 4-O-(4'-CH ₃ -C ₆ H ₄) | 20 |
| 145 | 2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-F | |
| 146 | 2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Cl | |
| 147 | 2,3,6-(CH ₃) ₃ , 4-Br | 25 |
| 148 | 2,4-(CH ₃) ₂ , 6-F | |
| 149 | 2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Cl | |
| 150 | 2,4-(CH ₃) ₂ , 6-Br | 30 |
| 151 | 2-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl, 5-CH ₃ | |
| 152 | 2-Cl, 4-NO ₂ | |
| 153 | 2-NO ₂ , 4-Cl | 35 |
| 154 | 2-OCH ₃ , 5-NO ₂ | |
| 155 | 2,4-Cl ₂ , 5-NO ₂ | |
| 156 | 2,4-Cl ₂ , 6-NO ₂ | 40 |
| 157 | 2,6-Cl ₂ , 4-NO ₂ | |
| 158 | 2,6-Br ₂ , 4-NO ₂ | |
| 159 | 2,6-J ₂ , 4-NO ₂ | 45 |
| 160 | 2-CH ₃ , 5-i-C ₃ H ₇ , 4-Cl | |
| 161 | 2-CO ₂ CH ₃ | |
| 162 | 3-CO ₂ CH ₃ | 50 |
| 163 | 4-CO ₂ CH ₃ | |
| 164 | 2-CH ₂ -OCH ₃ | |
| 165 | 3-CH ₂ -OCH ₃ | |
| 166 | 4-CH ₂ -OCH ₃ | 55 |
| 167 | 2-Me-4-CH ₃ -CH(CH ₃)-CO | |
| 168 | 2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃) | |
| 169 | 2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NOC ₂ H ₅) | 60 |
| 170 | 2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇) | |
| 171 | 2-CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇) | |
| 172 | 2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOCH ₃) | 65 |

| Nummer | R ^x _p |
|--------|---|
| 5 | 173 2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NOC ₂ H ₅) |
| 10 | 174 2,5-(CH ₃ -4-(CH ₃ -C=NO-n-C ₃ H ₇) |
| 15 | 175 2,5-(CH ₃) ₂ -4-(CH ₃ -C=NO-i-C ₃ H ₇) |
| 20 | 176 2-C ₆ H ₅ |
| 25 | 177 3-C ₆ H ₅ |
| 30 | 178 4-C ₆ H ₅ |
| 35 | 179 2-(2'-F-C ₆ H ₄) |
| 40 | 180 2-CH ₃ , 5-Br |
| 45 | 181 2-CH ₃ , 6-Br |
| 50 | 182 2-Cl, 3-CH ₃ |
| 55 | 183 2-Cl, 4-CH ₃ |
| 60 | 184 2-Cl, 5-CH ₃ |
| 65 | 185 2-F, 3-CH ₃ |
| | 186 2-F, 4-CH ₃ |
| | 187 2-F, 5-CH ₃ |
| | 188 2-Br, 3-CH ₃ |
| | 189 2-Br, 4-CH ₃ |
| | 190 2-Br, 5-CH ₃ |
| | 191 3-CH ₃ , 4-Cl |
| | 192 3-CH ₃ , 5-Cl |
| | 193 3-CH ₃ , 4-F |
| | 194 3-CH ₃ , 5-F |
| | 195 3-CH ₃ , 4-Br |
| | 196 3-CH ₃ , 5-Br |
| | 197 3-F, 4-CH ₃ |
| | 198 3-Cl, 4-CH ₃ |
| | 199 3-Br, 4-CH ₃ |
| | 200 2-Cl, 4,5-(CH ₃) ₂ |
| | 201 2-Br, 4,5-(CH ₃) ₂ |
| | 202 2-Cl, 3,5-(CH ₃) ₂ |
| | 203 2-Br, 3,5-(CH ₃) ₂ |
| | 204 2,6-Cl ₂ , 4-CH ₃ |
| | 205 2,6-F ₂ , 4-CH ₃ |
| | 206 2,6-Br ₂ , 4-CH ₃ |
| | 207 2,4-Br ₂ , 6-CH ₃ |
| | 208 2,4-F ₂ , 6-CH ₃ |
| | 209 2,4-Br ₂ , 6-CH ₃ |
| | 210 2,6-(CH ₃) ₂ , 4-F |
| | 211 2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Cl |

| Nummer | R ^x _p | |
|--------|--|----|
| 212 | 2,6-(CH ₃) ₂ , 4-Br | |
| 213 | 3,5-(CH ₃) ₂ , 4-F | 5 |
| 214 | 3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Cl | |
| 215 | 3,5-(CH ₃) ₂ , 4-Br | |
| 216 | 2-CF ₃ | 10 |
| 217 | 3-CF ₃ | |
| 218 | 4-CF ₃ | |
| 219 | 2-OCF ₃ | 15 |
| 220 | 3-OCF ₃ | |
| 221 | 4-OCF ₃ | |
| 222 | 3-OCH ₂ CHF ₂ | 20 |
| 223 | 2-NO ₂ | |
| 224 | 3-NO ₂ | |
| 225 | 4-NO ₂ | 25 |
| 226 | 2-CN | |
| 227 | 3-CN | |
| 228 | 4-CN | 30 |
| 229 | 2-CH ₃ , 3-Cl | |
| 230 | 2-CH ₃ , 4-Cl | |
| 231 | 2-CH ₃ , 5-Cl | 35 |
| 232 | 2-CH ₃ , 6-Cl | |
| 233 | 2-CH ₃ , 3-F | |
| 234 | 2-CH ₃ , 4-F | 40 |
| 235 | 2-CH ₃ , 5-F | |
| 236 | 2-CH ₃ , 6-F | |
| 237 | 2-CH ₃ , 3-Br | 45 |
| 238 | 2-CH ₃ , 4-Br | |
| 239 | 2-Pyridyl-2' | |
| 240 | 3-Pyridyl-3' | 50 |
| 241 | 4-Pyridyl-4' | |

55

60

65

Tabelle B

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ |
|--------|-----------------|-----------------|------------------------------|-------------------------------|
| 1 | H | H | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 2 | H | H | Benzyl | CH ₃ |
| 3 | H | H | 2-Pyridyl | CH ₃ |
| 4 | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ |
| 5 | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ |
| 6 | H | H | 2-Pyrazinyl | CH ₃ |
| 7 | H | H | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 8 | H | H | Benzyl | CH ₃ |
| 9 | H | H | 2-Pyridyl | CH ₃ |
| 10 | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ |
| 11 | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ |
| 12 | H | H | 2-Pyrazinyl | CH ₃ |
| 13 | CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 14 | CH ₃ | H | Benzyl | CH ₃ |
| 15 | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₃ |
| 16 | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ |
| 17 | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ |
| 18 | H | CH ₃ | 2-Pyrazinyl | CH ₃ |
| 19 | H | H | Cyclohexyl | C ₂ H ₅ |
| 20 | H | H | Benzyl | C ₂ H ₅ |
| 21 | H | H | Phenyl | C ₂ H ₅ |
| 22 | H | H | 2-Pyridyl | C ₂ H ₅ |
| 23 | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 24 | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 25 | H | H | 2-Pyrazinyl | C ₂ H ₅ |
| 26 | H | H | Cyclohexyl | C ₂ H ₅ |
| 27 | H | H | Benzyl | C ₂ H ₅ |
| 28 | H | H | Phenyl | C ₂ H ₅ |
| 29 | H | H | 2-Pyridyl | C ₂ H ₅ |
| 30 | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | |
|--------|----------------|-----------------|----------------|------------------------------|----------------------------------|
| 31 | H | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 32 | H | H | Cl | 2-Pyrazinyl | C ₂ H ₅ |
| 33 | H | CH ₃ | H | Cyclohexyl | C ₂ H ₅ |
| 34 | H | CH ₃ | H | Benzyl | C ₂ H ₅ |
| 35 | H | CH ₃ | H | Phenyl | C ₂ H ₅ |
| 36 | H | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | C ₂ H ₅ |
| 37 | H | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 38 | H | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 39 | H | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | C ₂ H ₅ |
| 40 | H | H | H | Cyclohexyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 41 | H | H | H | Benzyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 42 | H | H | H | Phenyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 43 | H | H | H | 2-Pyridyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 44 | H | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 45 | H | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 46 | H | H | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 47 | H | H | Cl | Cyclohexyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 48 | H | H | Cl | Benzyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 49 | H | H | Cl | Phenyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 50 | H | H | Cl | 2-Pyridyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 51 | H | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 52 | H | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 53 | H | H | Cl | 2-Pyrazinyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 54 | H | CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 55 | H | CH ₃ | H | Benzyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 56 | H | CH ₃ | H | Phenyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 57 | H | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 58 | H | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 59 | H | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 60 | H | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 61 | H | H | H | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 62 | H | H | H | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 63 | H | H | H | Phenyl | CH ₂ C≡CH |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ² | R ³ | R ⁴ |
|--------|----------------|-----------------|----------------|------------------------------|----------------------|
| 64 | H | H | H | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 5 | H | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 66 | H | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 10 | H | H | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 68 | H | H | Cl | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 15 | H | H | Cl | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 70 | H | H | Cl | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 71 | H | H | Cl | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 20 | H | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 73 | H | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 25 | H | H | Cl | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 75 | H | CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 76 | H | CH ₃ | H | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 30 | H | CH ₃ | H | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 78 | H | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 79 | H | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 35 | H | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 80 | H | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 40 | 3-F | H | H | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 82 | 3-F | H | H | Benzyl | CH ₃ |
| 83 | 3-F | H | H | Phenyl | CH ₃ |
| 45 | 3-F | H | H | 2-Pyridyl | CH ₃ |
| 85 | 3-F | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ |
| 50 | 3-F | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ |
| 87 | 3-F | H | H | 2-Pyrazinyl | CH ₃ |
| 55 | 3-F | H | Cl | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 89 | 3-F | H | Cl | Benzyl | CH ₃ |
| 90 | 3-F | H | Cl | Phenyl | CH ₃ |
| 60 | 3-F | H | Cl | 2-Pyridyl | CH ₃ |
| 92 | 3-F | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ |
| 65 | 3-F | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ |
| 94 | 3-F | H | Cl | 2-Pyrazinyl | CH ₃ |
| 95 | 3-F | H | Cl | | |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | |
|--------|----------------|-----------------|----------------|------------------------------|----------------------------------|
| 96 | 3-F | CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 97 | 3-F | CH ₃ | H | Benzyl | CH ₃ |
| 98 | 3-F | CH ₃ | H | Phenyl | CH ₃ |
| 99 | 3-F | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₃ |
| 100 | 3-F | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ |
| 101 | 3-F | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ |
| 102 | 3-F | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₃ |
| 103 | 3-F | H | H | Cyclohexyl | C ₂ H ₅ |
| 104 | 3-F | H | H | Benzyl | C ₂ H ₅ |
| 105 | 3-F | H | H | Phenyl | C ₂ H ₅ |
| 106 | 3-F | H | H | 2-Pyridyl | C ₂ H ₅ |
| 107 | 3-F | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 108 | 3-F | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 109 | 3-F | H | H | 2-Pyrazinyl | C ₂ H ₅ |
| 110 | 3-F | H | Cl | Cyclohexyl | C ₂ H ₅ |
| 111 | 3-F | H | Cl | Benzyl | C ₂ H ₅ |
| 112 | 3-F | H | Cl | Phenyl | C ₂ H ₅ |
| 113 | 3-F | H | Cl | 2-Pyridyl | C ₂ H ₅ |
| 114 | 3-F | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 115 | 3-F | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| 116 | 3-F | H | Cl | 2-Pyrazinyl | C ₂ H ₅ |
| 117 | 3-F | H | H | Cyclohexyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 118 | 3-F | H | H | Benzyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 119 | 3-F | H | H | Phenyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 120 | 3-F | H | H | 2-Pyridyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 121 | 3-F | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 122 | 3-F | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 123 | 3-F | H | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 124 | 3-F | H | Cl | Cyclohexyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 125 | 3-F | H | Cl | Benzyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 126 | 3-F | H | Cl | Phenyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 127 | 3-F | H | Cl | 2-Pyridyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 128 | 3-F | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ² | R ³ | R ⁴ |
|--------|----------------|-----------------|----------------|----------------------------------|----------------------------------|
| 129 | 3-F | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl -2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 130 | 3-F | H | Cl | 2-Pyrazinyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 131 | 3-F | CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 132 | 3-F | CH ₃ | H | Benzyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 133 | 3-F | CH ₃ | H | Phenyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 134 | 3-F | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 135 | 3-F | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 136 | 3-F | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl -2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 137 | 3-F | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 138 | 3-F | H | H | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 139 | 3-F | H | H | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 140 | 3-F | H | H | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 141 | 3-F | H | H | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 142 | 3-F | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 143 | 3-F | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl -2 | CH ₂ C≡CH |
| 144 | 3-F | H | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 145 | 3-F | H | Cl | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 146 | 3-F | H | Cl | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 147 | 3-F | H | Cl | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 148 | 3-F | H | Cl | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 149 | 3-F | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 150 | 3-F | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl -2 | CH ₂ C≡CH |
| 151 | 3-F | H | Cl | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 152 | 3-F | CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 153 | 3-F | CH ₃ | H | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 154 | 3-F | CH ₃ | H | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 155 | 3-F | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 156 | 3-F | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 157 | 3-F | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl -2 | CH ₂ C≡CH |
| 158 | 3-F | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 159 | 6-Cl | H | H | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 160 | 6-Cl | H | H | Benzyl | CH ₃ |
| 161 | 6-Cl | H | H | Phenyl | CH ₃ |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | |
|--------|----------------|-----------------|------------------------------|-------------------------------|----|
| 162 | 6-Cl | H | 2-Pyridyl | CH ₃ | |
| 163 | 6-Cl | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ | 5 |
| 164 | 6-Cl | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ | |
| 165 | 6-Cl | H | 2-Pyrazinyl | CH ₃ | 10 |
| 166 | 6-Cl | H | Cyclohexyl | CH ₃ | |
| 167 | 6-Cl | H | Benzyl | CH ₃ | |
| 168 | 6-Cl | H | Phenyl | CH ₃ | 15 |
| 169 | 6-Cl | H | 2-Pyridyl | CH ₃ | |
| 170 | 6-Cl | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ | 20 |
| 171 | 6-Cl | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ | |
| 172 | 6-Cl | H | 2-Pyrazinyl | CH ₃ | |
| 173 | 6-Cl | CH ₃ | Cyclohexyl | CH ₃ | 25 |
| 174 | 6-Cl | CH ₃ | Benzyl | CH ₃ | |
| 175 | 6-Cl | CH ₃ | Phenyl | CH ₃ | 30 |
| 176 | 6-Cl | CH ₃ | 2-Pyridyl | CH ₃ | |
| 177 | 6-Cl | CH ₃ | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ | 35 |
| 178 | 6-Cl | CH ₃ | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ | |
| 179 | 6-Cl | CH ₃ | 2-Pyrazinyl | CH ₃ | |
| 180 | 6-Cl | H | Cyclohexyl | C ₂ H ₅ | 40 |
| 181 | 6-Cl | H | Benzyl | C ₂ H ₅ | |
| 182 | 6-Cl | H | Phenyl | C ₂ H ₅ | |
| 183 | 6-Cl | H | 2-Pyridyl | C ₂ H ₅ | 45 |
| 184 | 6-Cl | H | 5-Cl-pyridyl-2 | C ₂ H ₅ | |
| 185 | 6-Cl | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | C ₂ H ₅ | 50 |
| 186 | 6-Cl | H | 2-Pyrazinyl | C ₂ H ₅ | |
| 187 | 6-Cl | H | Cyclohexyl | C ₂ H ₅ | |
| 188 | 6-Cl | H | Benzyl | C ₂ H ₅ | 55 |
| 189 | 6-Cl | H | Phenyl | C ₂ H ₅ | |
| 190 | 6-Cl | H | 2-Pyridyl | C ₂ H ₅ | 60 |
| 191 | 6-Cl | H | 5-Cl-pyridyl-2 | C ₂ H ₅ | |
| 192 | 6-Cl | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | C ₂ H ₅ | 65 |
| 193 | 6-Cl | H | 2-Pyrazinyl | C ₂ H ₅ | |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ |
|--------|----------------|-----------------|-----------------|------------------------------|
| 194 | 6-Cl | CH ₃ | H | Cyclohexyl |
| 5 | 195 | 6-Cl | CH ₃ | Benzyl |
| 196 | 6-Cl | CH ₃ | H | Phenyl |
| 10 | 197 | 6-Cl | CH ₃ | 2-Pyridyl |
| 198 | 6-Cl | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 |
| 15 | 199 | 6-Cl | CH ₃ | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| 200 | 6-Cl | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl |
| 201 | 6-Cl | H | H | Cyclohexyl |
| 202 | 6-Cl | H | H | Benzyl |
| 20 | 203 | 6-Cl | H | Phenyl |
| 204 | 6-Cl | H | H | 2-Pyridyl |
| 25 | 205 | 6-Cl | H | 5-Cl-pyridyl-2 |
| 206 | 6-Cl | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| 30 | 207 | 6-Cl | H | 2-Pyrazinyl |
| 208 | 6-Cl | H | Cl | Cyclohexyl |
| 209 | 6-Cl | H | Cl | Benzyl |
| 35 | 210 | 6-Cl | H | Phenyl |
| 211 | 6-Cl | H | Cl | 2-Pyridyl |
| 212 | 6-Cl | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 |
| 40 | 213 | 6-Cl | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| 214 | 6-Cl | H | Cl | 2-Pyrazinyl |
| 45 | 215 | 6-Cl | CH ₃ | Cyclohexyl |
| 216 | 6-Cl | CH ₃ | H | Benzyl |
| 217 | 6-Cl | CH ₃ | H | Phenyl |
| 50 | 218 | 6-Cl | CH ₃ | 2-Pyridyl |
| 219 | 6-Cl | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 |
| 55 | 220 | 6-Cl | CH ₃ | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| 221 | 6-Cl | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl |
| 60 | 222 | 6-Cl | H | Cyclohexyl |
| 223 | 6-Cl | H | H | Benzyl |
| 224 | 6-Cl | H | H | Phenyl |
| 65 | 225 | 6-Cl | H | 2-Pyridyl |
| 226 | 6-Cl | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ |
|--------|-------------------|-----------------|------------------------------|----------------------|
| 227 | 6-Cl | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 228 | 6-Cl | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 229 | 6-Cl | H | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 230 | 6-Cl | H | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 231 | 6-Cl | H | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 232 | 6-Cl | H | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 233 | 6-Cl | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 234 | 6-Cl | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 235 | 6-Cl | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 236 | 6-Cl | CH ₃ | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 237 | 6-Cl | CH ₃ | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 238 | 6-Cl | CH ₃ | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 239 | 6-Cl | CH ₃ | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 240 | 6-Cl | CH ₃ | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 241 | 6-Cl | CH ₃ | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 242 | 6-Cl | CH ₃ | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 243 | 6-CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 244 | 6-CH ₃ | H | Benzyl | CH ₃ |
| 245 | 6-CH ₃ | H | Phenyl | CH ₃ |
| 246 | 6-CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₃ |
| 247 | 6-CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ |
| 248 | 6-CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ |
| 249 | 6-CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₃ |
| 250 | 6-CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 251 | 6-CH ₃ | H | Benzyl | CH ₃ |
| 252 | 6-CH ₃ | H | Phenyl | CH ₃ |
| 253 | 6-CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₃ |
| 254 | 6-CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₃ |
| 255 | 6-CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₃ |
| 256 | 6-CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₃ |
| 257 | 6-CH ₃ | CH ₃ | Cyclohexyl | CH ₃ |
| 258 | 6-CH ₃ | CH ₃ | Benzyl | CH ₃ |
| 259 | 6-CH ₃ | CH ₃ | Phenyl | CH ₃ |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ |
|--------|-------------------|-------------------|-----------------|----------------------------------|
| 260 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 2-Pyridyl |
| 5 | 261 | 6-CH ₃ | CH ₃ | 5-Cl-pyridyl-2 |
| 10 | 262 | 6-CH ₃ | CH ₃ | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| 15 | 263 | 6-CH ₃ | CH ₃ | 2-Pyrazinyl |
| 20 | 264 | 6-CH ₃ | H | Cyclohexyl |
| 25 | 265 | 6-CH ₃ | H | Benzyl |
| 30 | 266 | 6-CH ₃ | H | Phenyl |
| 35 | 267 | 6-CH ₃ | H | 2-Pyridyl |
| 40 | 268 | 6-CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 |
| 45 | 269 | 6-CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| 50 | 270 | 6-CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl |
| 55 | 271 | 6-CH ₃ | Cl | Cyclohexyl |
| 60 | 272 | 6-CH ₃ | Cl | Benzyl |
| 65 | 273 | 6-CH ₃ | Cl | Phenyl |
| | 274 | 6-CH ₃ | Cl | 2-Pyridyl |
| | 275 | 6-CH ₃ | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 |
| | 276 | 6-CH ₃ | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| | 277 | 6-CH ₃ | Cl | 2-Pyrazinyl |
| | 278 | 6-CH ₃ | CH ₃ | Cyclohexyl |
| | 279 | 6-CH ₃ | CH ₃ | Benzyl |
| | 280 | 6-CH ₃ | CH ₃ | Phenyl |
| | 281 | 6-CH ₃ | CH ₃ | 2-Pyridyl |
| | 282 | 6-CH ₃ | CH ₃ | 5-Cl-pyridyl-2 |
| | 283 | 6-CH ₃ | CH ₃ | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| | 284 | 6-CH ₃ | CH ₃ | 2-Pyrazinyl |
| | 285 | 6-CH ₃ | H | Cyclohexyl |
| | 286 | 6-CH ₃ | H | Benzyl |
| | 287 | 6-CH ₃ | H | Phenyl |
| | 288 | 6-CH ₃ | H | 2-Pyridyl |
| | 289 | 6-CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 |
| | 290 | 6-CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 |
| | 291 | 6-CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl |
| | | | | CH ₂ OCH ₃ |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | |
|--------|-------------------|-----------------|----------------|------------------------------|----------------------------------|
| 292 | 6-CH ₃ | H | Cl | Cyclohexyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 293 | 6-CH ₃ | H | Cl | Benzyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 294 | 6-CH ₃ | H | Cl | Phenyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 295 | 6-CH ₃ | H | Cl | 2-Pyridyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 296 | 6-CH ₃ | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 297 | 6-CH ₃ | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 298 | 6-CH ₃ | H | Cl | 2-Pyrazinyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 299 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 300 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | Benzyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 301 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | Phenyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 302 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 303 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 304 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ OCH ₃ |
| 305 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ OCH ₃ |
| 306 | 6-CH ₃ | H | H | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 307 | 6-CH ₃ | H | H | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 308 | 6-CH ₃ | H | H | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 309 | 6-CH ₃ | H | H | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 310 | 6-CH ₃ | H | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 311 | 6-CH ₃ | H | H | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 312 | 6-CH ₃ | H | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 313 | 6-CH ₃ | H | Cl | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 314 | 6-CH ₃ | H | Cl | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 315 | 6-CH ₃ | H | Cl | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 316 | 6-CH ₃ | H | Cl | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 317 | 6-CH ₃ | H | Cl | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 318 | 6-CH ₃ | H | Cl | 5-CF ₃ -pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |
| 319 | 6-CH ₃ | H | Cl | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 320 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | Cyclohexyl | CH ₂ C≡CH |
| 321 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | Benzyl | CH ₂ C≡CH |
| 322 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | Phenyl | CH ₂ C≡CH |
| 323 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | CH ₂ C≡CH |
| 324 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | CH ₂ C≡CH |

| Nummer | R ¹ | R ² | R ³ | R ⁴ | | |
|--------|----------------|-------------------|-----------------|----------------|----------------------------------|-------------------------------|
| 5 | 325 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl -2 | CH ₂ C≡CH |
| 10 | 326 | 6-CH ₃ | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | CH ₂ C≡CH |
| 15 | 327 | 3-F | CH ₃ | H | Cyclohexyl | C ₂ H ₅ |
| 20 | 328 | 3-F | CH ₃ | H | Benzyl | C ₂ H ₅ |
| | 329 | 3-F | CH ₃ | H | Phenyl | C ₂ H ₅ |
| | 330 | 3-F | CH ₃ | H | 2-Pyridyl | C ₂ H ₅ |
| | 331 | 3-F | CH ₃ | H | 5-Cl-pyridyl-2 | C ₂ H ₅ |
| | 332 | 3-F | CH ₃ | H | 5-CF ₃ -pyridyl -2 | C ₂ H ₅ |
| | 333 | 3-F | CH ₃ | H | 2-Pyrazinyl | C ₂ H ₅ |

Die erfundungsgemäßen Verbindungen der Formel I eignen sich zur Bekämpfung von Schadpilzen und von tierischen Schädlingen aus der Klasse der Insekten, Spinnentiere und Nematoden. Sie können im Pflanzenschutz sowie auf dem Hygiene-, Vorratsschutz- und Veterinärsektor als Fungizide und Schädlingsbekämpfungsmittel eingesetzt werden.

Zu den schädlichen Insekten gehören:
aus der Ordnung der Schmetterlinge (Lepidoptera) beispielsweise Adoxophyes orana, Agrotis ypsilon, Agrotis segetum, Alabama argillacea, Anticarsia gemmatalis, Argyresthia conjugella, Autographa gamma, Cacoecia murinana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Chilo partellus, Choristoneura occidentalis, Cirphis unipuncta, Cnaphalocrocis medinalis, Crocidolomia binotalis, Cydia pomonella, Dendrolimus pini, Diaphania nitidalis, Diatraea grandiosella, Earias insulana, Elasmopalpus lignosellus, Eupoecilia ambiguella, Feltia subterranea, Grapholita funebrana, Grapholita molesta, Heliothis armigera, Heliothis virescens, Heliothis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea, Hyponomeuta malinellus, Keiferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exigua, Leucoptera scitella, Lithoccoletus blanckardella, Lobesia botrana, Loxostege sticticalis, Lymantria dispar, Lymantria monacha, Lyonetia clerkella, Manduca sexta, Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Mocis repanda, Operophtera brumata, Orgyia pseudotsugata, Ostrinia nubilalis, Pandemis heparana, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phthorimaea operculella, Phyllocoptis citrella, Pieris brassicae,
35 Plathypena scabra, Platynota stultana, Plutella xylostella, Prays citri, Prays oleae, Prodenia sunia, Prodenia ornithogalli, Pseudoplusia includens, Rhyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sesamia inferens, Sparganotis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Syllepta derogata, Synanthonedon myopaeformis, Thaumatopoea pityocampa, Tortrix viridana, Trichoplusia ni, Tryporyza incertulas, Zeiraphera canadensis, ferner Galleria mellonella und Sitotroga cerealella, Ephestia cautella, Tineola bisselliella;
40 aus der Ordnung der Käfer (Coleoptera) beispielsweise Agriotes lineatus, Agriotes obscurus, Anthonomus grandis, Anthonomus pomorum, Apion vorax, Atomaria linearis, Blastophagus piniperda, Cassida nebulosa, Cerotoma trifurcata, Ceuthorhynchus assimilis, Ceuthorhynchus napi, Chaetocnema tibialis, Conoderus vespertinus, Crioceris asparagi, Dendroctonus resipennis, Diabrotica longicornis, Diabrotica 12-punctata, Diabrotica virgifera, Epilachna varivestis, Epitrix hirtipennis, Eutinobothrus brasiliensis, Hylobius abietis, Hypera brunneipennis, Hypera postica, Ips typographus, Lema bilineata, Lema melanopus, Leptinotarsa decemlineata, Limonius californicus, Lissorhopterus oryzophilus, Melanotus communis, Meligethes aeneus, Melolontha hippocastani, Melolontha melolontha, Oulema oryzae, Ortiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Phaedon cochleariae, Phyllopertha horticola, Phyllophaga sp., Phyllotreta chrysocephala, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Psylliodes napi, Scolytus intricatus, Sitona lineatus, ferner Bruchus rufimanus, Bruchus pisorum, Bruchus latus, Sitophilus granaria, Lasioderma serricorne, Oryzaephilus surinamensis, Rhyzopertha dominica, Sitophilus oryzae, Tribolium castaneum, Trogoderma granarium, Zabrotes subfasciatus;
45 aus der Ordnung der Zweiflügler (Diptera) beispielsweise Anastrepha ludens, Ceratitis capitata, Contarinia sorghicola, Dacus cucurbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Delia coarctata, Delia radicum, Hydrellia griseola, Hylemyia platura, Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii, Mayetiola destructor, Orseolia oryzae, Oscinella frit, Pegomya hyoscyami, Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Tipula oleracea, Tipula paludosa, ferner Aedes aegypti, Aedes vexans, Anopheles maculipennis, Chrysomya bezziana, Chrysomya hominivorax, Chrysomya macellaris, Cordylobia anthropophaga, Culex pipiens, Fannia canicularis, Gasterophilus intestinalis, Glossina morsitans, Haematobia irritans, Haplodiplosis equestris, Hypoderma lineata, Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Musca domestica, Muscina stabulans, Oestrus ovis, Tabanus bovinus, Simulium damnosum;
50 aus der Ordnung der Thripse (Thysanoptera) beispielsweise Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Haplothrips tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi, Thrips tabaci;
55 aus der Ordnung der Hautflügler (Hymenoptera) beispielsweise Athalia rosae, Atta cephalotes, Atta sexdens,

Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Iridomyrmes humilis, Iridomyrmex purpureus, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata, Solenopsis invicta, Solenopsis richteri;
 aus der Ordnung der Wanzen (Heteroptera) beispielsweise Acrosternum hilare, Blissus leucopterus, Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius, Eurygaster integriceps, Euschistus impictiventris, Leptoglossus phyllopus, Lygus hesperus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis, Thyanta perditor;
 aus der Ordnung der Pflanzensauger (Homoptera) beispielsweise Acyrthosiphon onobrychis, Acyrthosiphon pisum, Adelges laricis, Aonidiella aurantii, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis gossypii, Aphis pomi, Aulacorthum solani, Bemisia tabaci, Brachycaudus cardui, Brevicoryne brassicae, Daubulus maidis, Dreyfusia nordmanniana, Dreyfusia piceae, Dysaphis radicola, Empoasca fabae, Eriosoma lanigerum, Laodelphax striatella, Macrosiphum avenae, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphon rosae, Megoura viciae, Metopolophium dirhodum, Myzus persicae, Myzus cerasi, Nephrotettix cincticeps, Nilaparvata lugens, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Planococcus citri, Psylla mali, Psylla piri, Psylla pyricol, Quadraspidiotus perniciosus, Rhopalosiphum maidis, Saissetia oleae, Schizaphis graminum, Selenaspis articulatus, Sitobion avenae, Sogatella furcifera, Toxoptera citricida, Trialeurodes abutilonea, Trialeurodes vaporariorum, Viteus vitifolii; aus der Ordnung der Termiten (Isoptera) beispielsweise Calotermes flavigollis, Leucotermes flavipes, Macrotermes subhyalinus, Odontotermes formosanus, Reticulitermes lucifugus, Termes natalensis;
 aus der Ordnung der Gerafflügler (Orthoptera) beispielsweise Gryllotalpa gryllotalpa, Locusta migratoria, Melanoplus bivittatus, Melanoplus femur-rubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Schistocerca americana, Schistocerca peregrina, Stauronotus maroccanus, Schistocerca gregaria, ferner Acheta domestica, Blatta orientalis, Blattella germanica, Periplaneta americana;
 aus der Ordnung der Arachnoidea beispielsweise phytophage Milben wie Aculops lycopersicae, Aculops pelekassi, Aculus schlechtendali, Brevipalpus phoenicis, Bryobia praetiosa, Eotetranychus carpini, Eutetranychus banksii, Eriophyes sheldoni, Oligonychus pratensis, Panonychus ulmi, Panonychus citri, Phyllocoptes oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Tarsonemus pallidus, Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus urticae, Zecken wie Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Argas persicus, Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus, Dermacentor silvarum, Hyalomma truncatum, Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus, Ornithodoros moubata, Otobius megnini, Rhipicephalus appendiculatus und Rhipicephalus evertsi sowie tierparasitische Milben wie Dermanyssus gallinae, Psoroptes ovis und Sarcoptes scabiei;
 aus der Klasse der Nematoden beispielsweise Wurzelgallennematoden, z. B. Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, zystenbildende Nematoden, z. B. Globodera pallida, Globodera rostochiensis, Heterodera avenae, Heterodera glycines, Heterodera schachtii, migratorische Endoparasiten und semi-endoparasitische Nematoden, z. B. Heliocotylenchus multicinctus, Hirschmanniella oryzae, Hoplolaimus spp, Pratylenchus brachyurus, Pratylenchus fallax, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus vulnus, Radopholus similis, Rotylenchus reniformis, Scutellonema bradys, Tylenchulus semipenetrans. Stock- und Blattnematoden z. B. Anguina tritici, Aphelenchoidea besseyi, Ditylenchus angustus, Ditylenchus dipsaci, Virusvektoren, z. B. Longidorus spp, Trichodorus christei, Trichodorus viruliferus, Xiphinema index, Xiphinema mediterraneum.

Die Verbindungen I können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z. B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Als Fungizide sind die Verbindungen der Formel I z. T. systemisch wirksam. Sie können als Blatt- und Bodenfungizide gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, Reis, Mais, Rasen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.

Speziell eignen sich die Verbindungen I zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:

Erysiphe graminis (echter Mehltau) in Getreide,
 Erysiphe cichoracearum und Sphaerotheca fuliginea an Kürbisgewächsen,
 Podosphaera leucotricha an Äpfeln,
 Uncinula necator an Reben,
 Puccinia-Arten an Getreide,
 Rhizoctonia-Arten an Baumwolle und Rasen,
 Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr,
 Venturia inaequalis (Schorf) an Äpfeln,
 Helminthosporium-Arten an Getreide,
 Septoria nodorum an Weizen,
 Botrytis cinerea (Grauschimmel) an Erdbeeren, Reben,
 Cercospora arachidicola an Erdnüssen,
 Pseudocercospora herpotrichoides an Weizen, Gerste,
 Pyricularia oryzae an Reis,
 Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten,
 Fusarium- und Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen,

Plasmopara viticola an Reben,
Alternaria-Arten an Gemüse und Obst.

Die neuen Verbindungen können auch im Materialschutz z. B. zum Schutz von Holz, Papier und Textilien eingesetzt werden, z. B. gegen *Paecilomyces variotii*.

5 Sie können in die üblichen Formulierungen übergeführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten oder Granulat. Die Anwendungformen richten sich dabei nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der Wirkstoffe gewährleisten.

10 Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z. B. durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können.

Als Hilfsstoffe kommen dafür im wesentlichen in Betracht:

15 — Lösungsmittel wie Aromaten (z. B. Xylo), chlorierte Aromaten (z. B. Chlorbenzole), Paraffine (z. B. Erdölfraktionen), Alkohole (z. B. Methanol, Butanol), Ketone (z. B. Cyclohexanon), Amine (z. B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser;

20 — Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z. B. Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z. B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate);

25 — Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z. B. polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und

30 — Dispergiermittel wie Ligninsulfat-Ablaugen und Methylcellulose.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z. B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen, sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfonierte Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfatblaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitstet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

40 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

45 Granulat, z. B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulat können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden.

Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Anlinoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe. Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden.

50 Ganz allgemein enthalten die Mittel zwischen 0,0001 und 95 Gew.-% Wirkstoff.

55 Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff können mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) ausgebracht werden, wobei sogar der Wirkstoff ohne Zusätze verwendet werden kann.

Für die Anwendung als Fungizide empfehlen sich Konzentrationen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-%, Wirkstoff. Für die Anwendung als Insektizide kommen Formulierungen mit 0,0001 bis 10 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 1 Gew.-% Wirkstoff, in Betracht.

Die Wirkstoffe werden normalerweise in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für solche Zubereitungen sind:

60 I. eine Lösung aus 90 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I und 10 Gew.-Teilen N-Methyl- α -pyrrolidon, die zur Anwendung in Form kleinsten Tropfen geeignet ist;

65 II. eine Lösung von 20 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I in einer Mischung aus 80 Gew.-Teilen alkyliertem Benzol, 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl; durch feines Verteilen der Formulierung in Wasser erhält man eine Dispersion.

70 III. eine Lösung von 20 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I in einer Mischung aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Iso-octylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl; durch feines Verteilen der Formulierung in Wasser erhält man eine

Dispersion.

IV. eine wässrige Dispersion aus 20 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I, in einer Mischung aus 25 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 65 Gew.-Teilen einer Mineralölfaktion vom Siedepunkt 210 bis 280 °C und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 mol Ethylenoxid an 1 mol Ricinusöl; durch feines Verteilen der Formulierung in Wasser erhält man eine Dispersion. 5

V. eine in einer Hammermühle vermahlene Mischung aus 20 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I, 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfitablaage und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel; durch feines Verteilen der Mischung in Wasser erhält man eine Spritzbrühe; 10

VI. eine innige Mischung aus 3 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I und 97 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin; dieses Stäubemittel enthält 3 Gew.-% Wirkstoff; 15

VII. eine innige Mischung aus 30 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I, 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprührt wurde; diese Aufbereitung gibt dem Wirkstoff eine gute Haftfähigkeit; 20

VIII. eine stabile wässrige Dispersion aus 40 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensates, 2 Gew.-Teilen Kieselgel und 48 Gew.-Teilen Wasser, die weiter verdünnt werden kann; 25

IX. eine stabile ölige Dispersion aus 20 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I, 2 Gew.-Teilen des Calciumsalzes der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gew.-Teilen Fettalkohol-polyglykol-ether, 2 Gew.-Teilen des Natriumsalzes eines Phenolsulfonsäure-harnstoff-formaldehyd-Kondensates und 68 Gew.-Teilen eines paraffinischen Mineralöls;

X. eine in einer Hammermühle vermahlene Mischung aus 10 Gew.-Teilen einer erfundungsgemäßen Verbindung I, 4 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 20 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfitablaage, 38 Gew.-Teilen Kieselsäuregel und 38 Gew.-Teilen Kaolin. Durch feines Verteilen der Mischung in 10 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.

Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Saatgäter, Pflanzen, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirkstoffe behandelt.

Die Anwendung erfolgt vor oder nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze.

Die Aufwandmengen liegen je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,02 und 3 kg Wirkstoff pro ha, vorzugsweise bei 0,1 bis 1 kg/ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 50 g, vorzugsweise 0,01 bis 10 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

Die Aufwandmenge an Wirkstoff für die Bekämpfung von Schädlings beträgt unter Freilandbedingungen 0,02 bis 10, vorzugsweise 0,1 bis 2,0 kg/ha Wirkstoff. 35

Die Verbindungen I, allein oder in Kombination mit Herbiziden oder Fungiziden, können auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam ausgebracht werden, beispielsweise mit Wachstumsregulatoren oder mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlings oder Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischarkeit mit Düngemitteln oder mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. 40

Die Pflanzenschutz- und Düngemittel können zu den erfundungsgemäßen Mitteln im Gewichtsverhältnis 1 : 10 bis 10 : 1 zugesetzt werden, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix). Beim Vermischen mit Fungiziden oder Insektiziden erhält man dabei in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums. 45

Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfundungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:

Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethylthiocarbamat, Zinkdimethylthiocarbamat, Zinkethylenbisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zink-ethylendiamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide, Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-bis-(thiocarbamoyl)-disulfid; Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat, 2-sec-Butyl-4, 6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat, 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat, 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester; 55

heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, O,O-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1- β -[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachinon, 2-Thio-1,3-dithiolo- β -[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamoyl)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonylamino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2)-benzimidazol, 2-(Thiazolyl-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid, N-Trichlormethylthiophthalimid, N-Dichlorfluormethylthio-N',N'-dimethyl-N-phenylschwefelsäure-diamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanmethylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazolon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,4,5-Trimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2, 5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsäureamid, 2-Methyl-benzoësäure-anilid, 2-Iodbenzoësäure-anilid, N-Formyl-N-morpholin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diyli-bis-(1-(2,2,2-trichlor-ethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-formylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-

N-tridecyl-morpholin bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclodedecyl-morpholin bzw. dessen Salze, N-[3-(p-tert-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethylmorpholin, N-[3-(p-tert-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-ylethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(IH-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol, a-(2-Chlorphenyl)- α -(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydroxy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol, sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat, 3-[3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohexyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid, Hexachlorbenzol, DL-Methyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat, DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methylester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethyllester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-dioxo-1,3-oxazolidin, 3-[3,5-Dichlorphenyl]-(5-methyl-5-methoxymethyl)-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäure imid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pentyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor- α -(1H-1,2,4-triazolyl-1-methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin, 1-((bis-(4-Fluorophenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol.

20 **Synthesebeispiele**

Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Daten aufgeführt.

25 **1. N-(2-(p-Methylphenyl)-4'-chlor-pyrazolyl-3'-oxymethyl)-phenyl)-N-methoxy-carbaminsäuremethylester (Tabelle, Nr. 19).**

Eine Mischung von 1,7 g (Reinheit ca. 75%ig, \approx 4,6 mmol) N-(2-Brommethylphenyl)-N-methoxy-carbaminsäuremethylester (WO 93/15046), 1 g (4,8 mmol) N-(p-Methylphenyl)-4-chlor-3-hydroxypyrazol und 1 g (7,2 mmol) K_2CO_3 in 15 ml Dimethylformamid wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend verdünnt man die Reaktionsmischung mit Wasser und extrahiert die wäßrige Phase dreimal mit Methyl-t-butyl-ether. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser extrahiert, über $MgSO_4$ getrocknet und eingeengt. Dann wird der Rückstand mit Methylchlorid über Al_2O_3 und anschließend mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen über Kieselgel chromatographiert. Man erhält 1,4 g (68%) der Titelverbindung als hellgelbes Öl.
 1H -NMR($CDCl_3$; δ in ppm): 7,75 (s, 1H, Pyrazolyl); 7,70 (m, 1H, Phenyl); 7,5 (m, 5H, Phenyl); 7,2 (d, 2H, Phenyl); 5,4 (s, 2H, OCH_2), 3,75, 3,8 (2s, je 3H, 2 \times OCH_3), 2,35 (s, 3H, CH_3).

40 **2. N-Methyl-N'-methoxy-N'-(2-((N''-pyrazinyl)-pyrazolyl-3''-oxymethyl)-phenyl)-harnstoff (Tabelle, Nr. 32).****a) N-Hydroxy-N-(2-methylphenyl)-carbaminsäurephenylester**

Eine Mischung von 350 g (Reinheit ca. 80%ig; 2,3 mol; hergestellt analog Bamberger et al., Anm. Chem. 316 (1901), 278) N-(2-Methylphenyl)-hydroxylamin und 286,8 g (3,4 mol) $NaHCO_3$ in 700 ml CH_2Cl_2 wird bei ca. $-10^\circ C$ unter kräftigem Rühren mit 447 g (2,85 mol) Phenylchlorformiat versetzt. Man röhrt ca. eine Stunde bei $-10^\circ C$ und tropft anschließend 600 ml Wasser hinzu, wobei sich die Temperatur der Reaktionsmischung auf 5–10°C erhöht und eine starke Gasentwicklung eintritt. Dann wird die wäßrige Phase abgetrennt und noch einmal mit CH_2Cl_2 extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser extrahiert, über $MgSO_4$ getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisiert und wird mit Cyclohexan ausgerührt. Man erhält 407 g (72%) der Titelverbindung als farblosen Festkörper.
 1H -NMR($CDCl_3$; δ in ppm): 8,6 (s, breit, 1H, OH); 7,0–7,4 (m, 9H, Phenyl), 2,4 (s, 3H, CH_3).

b) N-Methoxy-N-(2-methylphenyl)-carbaminsäurephenylester

Eine Mischung von 407 g (1,6 mol) N-Hydroxy-N-(2-methylphenyl)-carbaminsäurephenylester (Beispiel 2a) und 277 g (2,0 mol) K_2CO_3 in 700 ml CH_2Cl_2 wird tropfenweise mit 211 g (1,67 mol) Dimethylsulfat versetzt. Dabei erwärmt sich die Reaktionsmischung auf ca. 40°C. Man röhrt über Nacht bei Raumtemperatur und filtriert anschließend die Reaktionsmischung über Kieselgur. Das Filtrat wird mit NH_3 -Lsg. und Wasser gewaschen, über $MgSO_4$ getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisiert und wird mit Hexan ausgerührt. Man erhält 324 g (75%) der Titelverbindung als farblosen Festkörper.
 1H -NMR($CDCl_3$; δ in ppm): 7,1–7,6 (m, 9H, Phenyl); 3,8 (s, 3H, OCH_3); 2,4 (s, 3H, CH_3).

c) N-Methoxy-N-(2-brommethylphenyl)-carbaminsäurephenylester

Eine Mischung von 324 g (1,3 mol) N-Methoxy-N-(2-methylphenyl)-carbaminsäurephenylester (Beispiel 2b), 258 g (1,45 mol) N-Bromsuccinimid und 1 g Azoisobutyrodinitril in 1 l CCl_4 wird ca. 6 Stunden mit einer 300 W UV-Lampe bestrahlt, wodurch die Reaktionsmischung zum Sieden erhitzt wird. Anschließend gibt man 13 g

N-Bromsuccinimid hinzu und bestrahlt weitere 8 Stunden. Dann kühlt man auf Raumtemperatur und filtriert das ausgefallene Succinimid ab. Anschließend wird die organische Phase mit Wasser extrahiert, über $MgSO_4$ getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisiert und wird mit Cyclohexan ausgerührt. Man erhält 300 g (68%) der Titelverbindung als beigen Festkörper.

1H -NMR($CDCl_3$; δ in ppm): 7,0–7,6 (m, 9H, Phenyl); 4,65 (s, 2H, CH_2-Br); 3,9 (s, 3H, OCH_3)

5

d) N-Methoxy-N-(2-((N'-pyrazinyl)-pyrazolyl-3'-oxymethyl)-phenyl)-carbaminsäurephenylester

Eine Mischung von 3,1 g (9,2 mmol) N-Methoxy-N-(2-brommethylphenyl)-carbaminsäurephenylester (Beispiel 2c), 1,5 g (9,2 mmol) N-Pyrazinyl-3-hydroxypyrazol und 2 g (14,5 mmol) K_2CO_3 in 10 ml DMF wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird die Reaktionsmischung mit Wasser verdünnt und dreimal mit Methyl-t-butylether extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser extrahiert, über $MgSO_4$ getrocknet und eingeengt. Der Rückstand wird säulenchromatographisch mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen gereinigt. Man erhält 2,4 g (63%) der Titelverbindung als gelbes Öl.

1H -NMR($CDCl_3$; δ in ppm): 9,15 (d, 1H, Pyrazolyl); 8,3 (m, 3H, Pyrazinyl); 7,7 (m, 1H, Phenyl); 7,1–7,6 (m, 8H, Phenyl); 6,0 (d, 1H, Pyrazolyl); 5,5 (s, 2H, OCH_2); 3,85 (s, 3H, OCH_3).

10

15

e) N-Methyl-N'-methoxy-N'-(2-((N'-pyrazinyl)-pyrazolyl-3'-oxymethyl)-phenyl)-harnstoff

Eine Mischung von 1,9 g (4,6 mmol) N-Methoxy-N-(2-((N'-pyrazinyl)-pyrazolyl-3'-oxymethyl)-phenyl)-carbaminsäure phenylester (Beispiel 2d) und 15 ml wäbriger Methylamin-Lösung (40%ig) wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend gibt man Wasser hinzu und extrahiert die wäbrige Phase zweimal mit Methylenchlorid. Die vereinigten organischen Phasen werden mit Wasser gewaschen, über $MgSO_4$ getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisiert und wird mit Cyclohexan ausgerührt. Man erhält 0,9 g (55%) der Titelverbindung als beigen Festkörper.

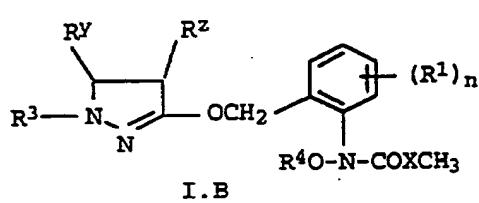
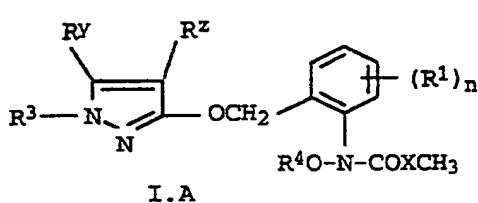
1H -NMR($CDCl_3$; δ in ppm): 9,15 (d, 1H, Pyrazolyl); 8,3 (m, 3H, Pyrazinyl); 7,6 (m, 1H, Phenyl); 7,35 (m, 3H, Phenyl); 6,0 (m, 2H, NH, Pyrazinyl); 5,45 (s, 2H, OCH_2); 3,7 (s, 3H, OCH_3); 2,9 (d, 3H, NCH_3).

20

25

Tabelle

30



35

40

| Nr. | Struktur | R^1 n | RY | R^z | R^3 | R^4 | X | F_D [$^{\circ}C$], IR [cm^{-1}] |
|-----|----------|--------------|------|-------|---------------------|--------|---|--|
| 1 | I.A | H | H | H | H | CH_3 | O | 1737, 1600, 1493, 1480, 1456, 1358, 1332, 755 |
| 2 | I.A | H | H | H | 4-Cl | CH_3 | O | 1737, 1547, 1503, 1480, 1457, 1441, 1350, 1094, 1030, 936 |
| 3 | I.A | H | H | H | 2,4-Cl ₂ | CH_3 | O | 1739, 1547, 1492, 1475, 1457, 1440, 1356, 1107, 1058, 1027 |
| 4 | I.A | H | H | H | 2-CH ₃ | CH_3 | O | 1739, 1710, 1542, 1482, 1457, 1440, 1358, 1052, 1030, 763 |

45

50

55

60

65

| Nr. | Struk-tur | R ¹ n | R ^Y | R ^Z | R ³ | R ⁴ | X | Fp [°C], IR [cm ⁻¹] | |
|-----|-----------|---------------------|----------------|----------------|--------------------------|--------------------------|-----------------|---|--|
| 5 | I.A | H | H | H | 3-CH ₃ | CH ₃ | O | 1738, 1593, 1545, 1494, 1483, 1457, 1441, 1357, 1056, 1032 | |
| 10 | 6 | I.A | H | H | H | 4-CH ₃ | CH ₃ | O | 1738, 1544, 1519, 1482, 1456, 1440, 1393, 1358, 1243, 1031, |
| 15 | 7 | I.A | H | H | H | 2-Cl | CH ₃ | O | 1739, 1710, 1546, 1495, 1476, 1453, 1441, 1358, 1027, 757 |
| 20 | 8 | I.A | H | H | H | 3-Cl | CH ₃ | O | 1736, 1597, 1548, 1495, 1476, 1456, 1440, 1357, 1101, 771 |
| 25 | 9 | I.A | H | H | H | 2,6-Cl ₂ | CH ₃ | O | 1727, 1543, 1464, 1445, 1364, 1348, 791, 785, 749, |
| 30 | 10 | I.A | H | H | H | 3,5-Cl ₂ | CH ₃ | O | 120 |
| 35 | 11 | I.A | H | H | H | 2,5-Cl ₂ | | O | 1737, 1710, 1547, 1489, 1471, 1456, 1437, 1346, 1096, 1027 |
| 40 | 12 | I.A | H | H | H | 3,4-Cl ₂ | CH ₃ | O | 85 |
| 45 | 13 | I.A | H | H | H | 2-CH ₃ , 4-Cl | CH ₃ | O | 1738, 1710, 1543, 1494, 1480, 1457, 1441, 1358, 1100, 940 |
| 50 | 14 | I.A | H | H | H | 3-CF ₃ | CH ₃ | O | 1721, 1558, 1459, 1441, 1368, 1333, 1121, 1067, 793, 764 |
| 55 | 15 | I.A | H | H | H | 4-OCH ₃ | CH ₃ | O | 1737, 1541, 1517, 1483, 1457, 1442, 1359, 1250, 1056, 1032 |
| 60 | 16 | I.A | H | H | H | H | CH ₃ | O | 1739, 1710, 1560, 1504, 1484, 1456, 1440, 1380, 1359, 760 |
| 65 | 17 | I.A | H | H | CH ₃ O-C O | H | CH ₃ | O | 1720, 1702, 1570, 1540, 1446, 1372, 1357, 1285, 1119, 751 |

| Nr. | Struk-tur | R ¹ n | R ^Y | R ^Z | R ³ | R ⁴ | X | Fp [°C], IR [cm ⁻¹] |
|-----|-----------|---------------------|----------------|-----------------|--|-----------------|----|---|
| 18 | I.A | H | H | H | 4-F | CH ₃ | O | 1737, 1546, 1516, 1482, 1457, 1440, 1359, 1233, 1031, 835 |
| 19 | I.A | H | H | Cl | 4-CH ₃ | CH ₃ | O | 1738, 1554, 1509, 1456, 1440, 1358, 1253, 1118, 940, 760 |
| 20 | I.A | H | H | H | 2,4-Cl ₂ | CH ₃ | O | 90 |
| 21 | I.A | H | H | H | 2,4-Cl ₂ | CH ₃ | O | 109 |
| 22 | I.A | H | H | H | 3-OCH ₃ | CH ₃ | O | 1737, 1607, 1597, 1545, 1499, 1482, 1472, 1440, 1358 |
| 23 | I.A | H | H | Cl | 2,4-Cl ₂ | CH ₃ | O | 110 |
| 24 | I.A | H | H | H | 2,4-Cl ₂ | CH ₃ | O | 1739, 1507, 1486, 1457, 1359, 1250, 1190, 1139, 1109, 1092 |
| 25 | I.A | H | H | H | 2,4-Cl ₂ | CH ₃ | O | 1738, 1710, 1567, 1561, 1500, 1484, 1456, 1440, 1359, 1104 |
| 26 | I.A | H | H | Cl | 4-Cl | CH ₃ | O | 1729, 1553, 1511, 1497, 1438, 1356, 1332, 1265, 1122, 1112 |
| 27 | I.A | H | H | H | 3,4-(OCF ₂ O) -C ₆ H ₃ | CH ₃ | O | 97 |
| 28 | I.A | H | H | H | 2-pyridyl | CH ₃ | O | 85 |
| 29 | I.A | H | H | H | 5-CF ₃ -pyri-dyl-2 | CH ₃ | O | 81 |
| 30 | I.A | H | H | H | 2-pyrazinyl | CH ₃ | O | 87 |
| 31 | I.B | H | H | H | C ₆ H ₅ | CH ₃ | O | 1739, 1639, 1599, 1501, 1456, 1439, 1411, 1354, 1252, 752 |
| 32 | I.A | H | H | H | 2-pyrazinyl | CH ₃ | NH | 145 |
| 33 | I.A | H | H | NO ₂ | 5-CF ₃ -pyri-dyl-2 | CH ₃ | O | 126 |

Beispiele zur Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der Formel I ließ sich durch folgende Versuche zeigen:
 Die Wirkstoffe wurden als 20%-ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN-(Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Aikylphenole) und 10 Gew.-% Emulphor® EL (Emulan® EL, Emulgator auf der Basis ethoxylierter Fettalkohole) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

Wirksamkeit gegen *Puccinia recondita*

5 Blätter von Weizensämlingen (Sorte "Kanzler") wurden mit Sporen des Braunrosts (*Puccinia recondita*) bestäubt. Die so behandelten Pflanzen wurden 24 h bei 20–22°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 90–95% inkubiert und anschließend mit der wäßrigen Wirkstoffaufbereitung (63 ppm Wirkstoff) behandelt. Nach weiteren 8 Tagen bei 20–22°C und 65–70% relativer Luftfeuchtigkeit wurde das Ausmaß der Pilzentwicklung ermittelt. Die Auswertung erfolgte visuell.

10 In diesem Test zeigten die mit den erfundungsgemäßen Verbindungen 2–6, 8, 11–15, 18–20, 22, 23 und 26–29 behandelten Pflanzen einen Befall von 5% und weniger, während die mit einer aus WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 7, Beispiel Nr. 8) behandelten Pflanzen zu 25% befallen waren. Die unbehandelten Pflanzen waren zu 70% befallen.

15 In einem entsprechenden Versuch zeigten die mit 250 ppm der erfundungsgemäßen Verbindung Nr. 1 behandelten Pflanzen einen Befall von 3% während Pflanzen, die mit 250 ppm einer aus WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 7, Nr. 21) behandelt waren ebenso wie die unbehandelten Pflanzen zu 70% befallen waren.

15 Wirksamkeit gegen *Plasmopara viticola*

20 Topfreben (Sorte: "Müller Thurgau") wurden mit der Wirkstoffaufbereitung tropfnaß gespritzt. Nach 8 Tagen wurden die Pflanzen mit einer Zoosporenaufschwemmung des Pilzes *Plasmopara viticola* besprüht und 5 Tage bei 20–30°C bei hoher Luftfeuchtigkeit bewahrt. Vor der Beurteilung wurden die Pflanzen danach für 16 h bei hoher Luftfeuchtigkeit bewahrt.

Die Auswertung erfolgte visuell.

25 In diesem Test zeigten die mit den erfundungsgemäßen Verbindungen 1–3, 5, 6, 13, 15 und 29 behandelten Pflanzen einen Befall von 10% und weniger, während die mit einer aus WO-A 39/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 7, Beispiel Nr. 8) behandelten Pflanzen zu 25% befallen waren. Die unbehandelten Pflanzen waren zu 70% befallen.

Wirksamkeit gegen *Botrytis cinerea*

30 Paprikasämlinge (Sorte: "Neusiedler Ideal Elite") mit 4–5 Blättern wurden mit der Wirkstoffaufbereitung (Aufwandmenge: 500 ppm) tropfnaß gespritzt. Nach dem Abrocknen wurden die Pflanzen mit einer Konidienaufschwemmung des Pilzes *Botrytis cinerea* besprüht und 5 Tage bei 22–24°C bei hoher Luftfeuchtigkeit bewahrt. Die Auswertung erfolgte visuell.

35 In diesem Test zeigten die mit der erfundungsgemäßen Verbindung Nr. 1 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die mit einer aus WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 7, Nr. 21) behandelten Pflanzen zu 70% befallen waren. Die unbehandelten Pflanzen waren zu 80% befallen.

Wirksamkeit gegen *Erysiphe graminis* var. *tritici*

40 Blätter von Weizenkeimlingen (Sorte "Frühgold") wurden zunächst mit der wäßrigen Aufbereitung (Aufwandmenge 250 ppm) der Wirkstoffe behandelt. Nach ca. 24 h wurden die Pflanzen mit Sporen des Weizenmehltaus (*Erysiphe graminis* var. *tritici*) bestäubt. Die so behandelten Pflanzen wurden anschließend für 7 Tage bei 20–22°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 75–80% inkubiert. Anschließend wurde das Ausmaß der Pilzentwicklung ermittelt.

45 In diesem Test zeigten die mit der erfundungsgemäßen Verbindung Nr. 1 behandelten Pflanzen keinen Befall, während die mit einer aus WO-A 93/15,046 bekannten Verbindung (Tabelle 7, Nr. 21) behandelten Pflanzen zu 25% befallen waren. Die unbehandelten Pflanzen waren zu 70% befallen.

Beispiele zur Wirkung gegen tierische Schädlinge

50 50 Die Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I gegen tierische Schädlinge ließ sich durch folgende Versuche zeigen:
Die Wirkstoffe wurden

55 a) als 0,1%-ige Lösung in Aceton oder
b) als 10%-ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Emulphor® EL (Emulan® EL, Emulgator auf der Basis ethoxylierter Fettalkohole) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Aceton im Fall von a) bzw. mit Wasser im Fall von b) verdünnt.

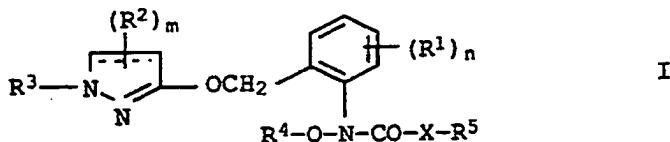
60 Nach Abschluß der Versuche wurde die jeweils niedrigste Konzentration ermittelt, bei der die Verbindungen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollversuchen noch eine 80–100%-ige Hemmung bzw. Mortalität hervorriefen (Wirksschwelle bzw. Minimalkonzentration).

65

Patentansprüche

1. 2-[(Dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]-anilide der Formel I

5



10

in der — für eine Einfach- oder Doppelbindung steht und die Indices und die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist; 15

m 0, 1 oder 2, wobei die Substituenten R² verschieden sein können, wenn m größer als 1 ist;

X eine direkte Bindung, O oder NR^a;

R^a Wasserstoff, Alkyl, Alkenyl, Alkiny, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl;

R¹ Nitro, Cyano, Halogen,

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkiny, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkinyloxy oder für den Fall, daß n für 2 steht zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;

R² Nitro, Cyano, Halogen, C₁—C₄-Alkyl, C₁—C₄-Halogenalkyl, C₁—C₄-Alkoxy, C₁—C₄-Alkylthio oder C₁—C₄-Alkoxy carbonyl; 25

R³ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl oder Alkiny; ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder ein ggf. subst. ein- oder zweikerniger aromatischer Rest, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann; 30

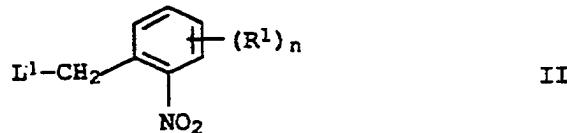
R⁴ Wasserstoff,

ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkiny, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxy carbonyl;

R⁵ Alkyl, Alkenyl, Alkiny, Cycloalkyl oder Cycloalkenyl, oder

für den Fall, daß X für NR^a steht, zusätzlich Wasserstoff.

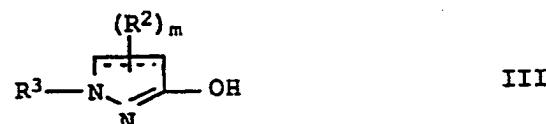
2. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1, in denen R⁴ Wasserstoff bedeutet, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Benzylderivat der Formel II, 35



40

in der L¹ eine nucleophil austauschbare Gruppe bedeutet und X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxy(dihydro)pyrazol der Formel III

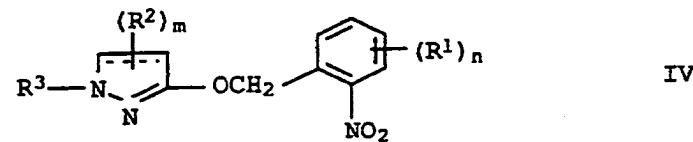
45



50

in das entsprechende 2-[(Dihydro)pyrazolyl-3'-oxymethylen]-nitrobenzol der Formel IV

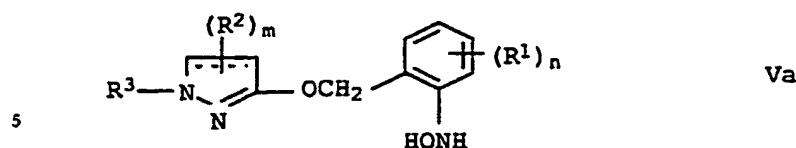
55



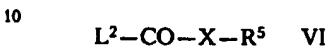
60

überführt, IV anschließend zum N-Hydroxyanilin der Formel Va

65

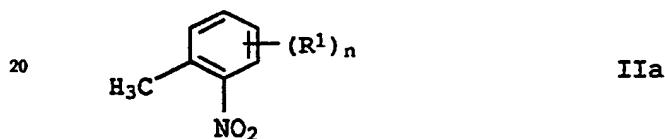


reduziert und Va mit einer Carbonylverbindung der Formel VI

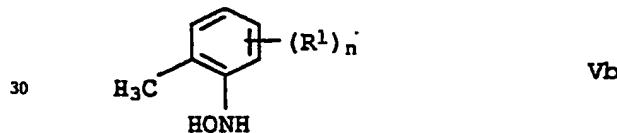


in der L^2 Halogen bedeutet, in I umwandelt.

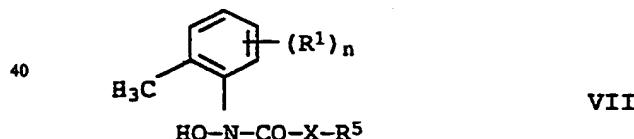
15 3. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, in denen R^4 nicht Wasserstoff bedeutet und X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Benzyllderivat der Formel IIa



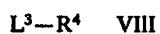
25 zunächst zum entsprechenden Hydroxyanilin der Formel Vb



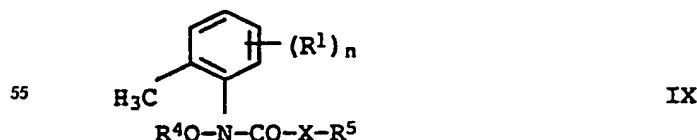
35 reduziert, Vb mit einer Carbonylverbindung der Formel VI gemäß Anspruch 2 in das entsprechende Anilid der Formel VII



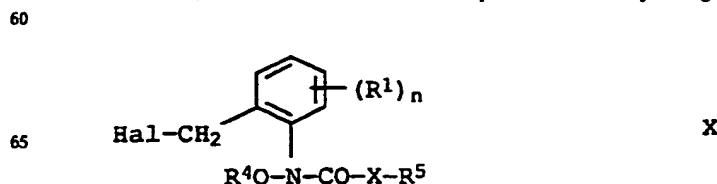
45 überführt, VII anschließend mit einer Verbindung VIII



50 in der L^3 eine nucleophil austauschbare Gruppe bedeutet und R^4 nicht für Wasserstoff steht, in das Amid der Formel IX



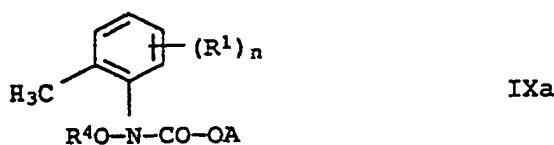
überführt, IX anschließend in das entsprechende Benzylhalogenid der Formel X



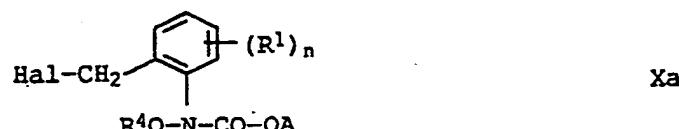
in der Hal für ein Halogenatom steht, überführt und X in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxy(dihydro)pyrazol der Formel III gemäß Anspruch 2 in I umwandelt.

4. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1, in denen R⁴ nicht Wasserstoff bedeutet und X für eine direkte Bindung oder Sauerstoff steht, dadurch gekennzeichnet, daß man eine entsprechende Verbindung der Formel I, in der R⁴ Wasserstoff bedeutet, mit einer Verbindung der Formel VIII gemäß Anspruch 3 umsetzt.

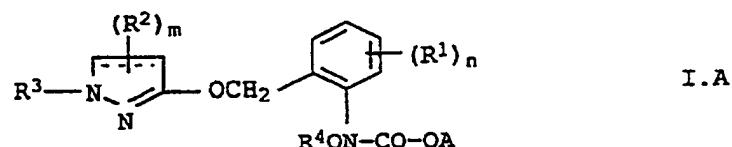
5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I, in denen X für NRA steht, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Benzylanilid der Formel IXa



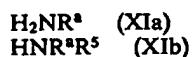
in der A für Alkyl oder Phenyl steht, in das entsprechende Benzylhalogenid der Formel Xa



in der Hal für ein Halogenatom steht, überführt, Xa in Gegenwart einer Base mit einem 3-Hydroxy(dihydro)pyrazol der Formel III gemäß Anspruch 2 in eine Verbindung der Formel I.A

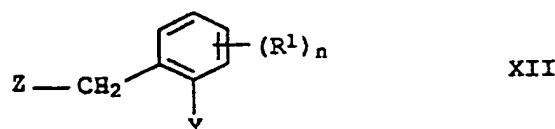


überführt und I.A anschließend mit einem primären oder sekundären Amin der Formel XI



zu I umsetzt.

6. Zwischenprodukte der Formel XII



in der die Substituenten und der Index die folgende Bedeutung haben:

n 0, 1, 2, 3 oder 4, wobei die Substituenten R¹ verschieden sein können, wenn n größer als 1 ist;

R¹ Nitro, Cyano, Halogen,

ggf. subst. -Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Alkoxy, Alkenyloxy, Alkynyloxy oder

für den Fall, daß n für 2 steht zusätzlich eine an zwei benachbarte Ringatome gebundene ggf. subst. Brücke, welche drei bis vier Glieder aus der Gruppe 3 oder 4 Kohlenstoffatome, 1 bis 3 Kohlenstoffatome und 1 oder 2 Stickstoff-, Sauerstoff- und/oder Schwefelatome enthält, wobei diese Brücke gemeinsam mit dem Ring an den sie gebunden ist einen partiell ungesättigten oder aromatischen Rest bilden kann;

Y NO₂, NHOH oder NHOR⁴

R⁴ ggf. subst. Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Alkylcarbonyl oder Alkoxy carbonyl;

Z Wasserstoff, Hydroxy, Mercapto, Cyano, Nitro, Halogen, C₁—C₆-Alkylsulfonyl, ggf. subst. Arylsulfonyl oder eine Gruppe Z^a

5

10

15

20

25

30

35

40

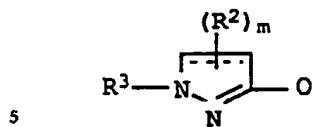
45

50

55

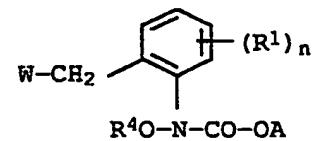
60

65



Za

m 0, 1 oder 2, wobei die Substituenten R^2 verschieden sein können, wenn m größer als 1 ist;
 10 R^2 Nitro, Cyano, Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, C_1-C_4 -Halogen, alkyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Alkythio oder
 C_1-C_4 -Alkoxy carbonyl;
 15 R^3 ggf. subst. Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl;
 ein ggf. subst. gesättigter oder ein- oder zweifach ungesättigter Ring, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis drei der folgenden Heteroatome als Ringglieder enthalten kann: Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff, oder
 20 ein ggf. subst. ein- oder zweikerniger aromatischer Rest, welcher neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein oder zwei Stickstoffatome und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom als Ringglieder enthalten kann.
 7. Zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
 8. Zwischenprodukte der allgemeinen Formel XIII



XIII

wobei die Substituenten R^1 und R^4 sowie der Index n die in Anspruch 1 gegebene Bedeutung haben und die Substituenten W und A die folgende Bedeutung haben:
 30 W Wasserstoff oder Halogen, und
 A Alkyl oder Phenyl.
 9. Verwendung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen oder Schadpilzen geeigneten Mittels.
 35 10. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.
 11. Verfahren zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Schädlinge oder die von ihnen zu schützenden Materialien, Pflanzen, Boden oder Saatgüter mit einer wirksamen Menge einer Verbindung der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

45

50

55

60

65